

(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有權機關  
國際事務局



(43) 國際公開日  
2003 年 12 月 4 日 (04.12.2003)

**PCT**

(10) 国際公開番号  
WO 03/099765 A1

(51) 國際特許分類: C07C 233/83, 311/46, C07D 209/16, 313/10, 313/06, 107/53, 311/70, 401/13, 405/13, 409/12.

[illegible]

(21) 國際出願番号: PCT/JPO3/06678

(22) 國際出版日: 2003年5月28日(28.05.2003)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

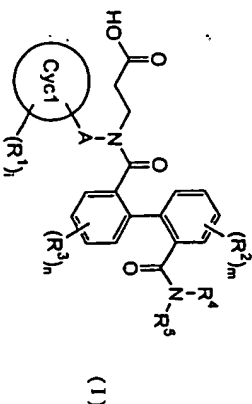
(30) 阪先権子一々: 2002年5月28日(28.05.2002) 11

(71) 出願人(米國)を換ぐ金での指定国について: 外資  
製品工業株式会社 (ONO PHARMACEUTICAL CO.  
LTD.) [P]/P: 〒541-8326 大阪府 大阪市 中央区道頓  
町2丁目1番8号 Osaka (JP).

(172) 免明者; および  
(175) 免明者/出願人 (米国についてのみ); 市下  
(HABASHITA, Hiromu) [P/P]; 〒618-8585 大阪府三

(54) Title:  $\beta$ -ALANINE DERIVATIVE AND USE THEREOF

(5.4) 発明の名称:  $\beta$ -7 ラニン誘導体およびその用途



(diseases accompanied by abnormal angiogenesis, blocked artery and lung neoplasia; hepatitis and pneumonia, diseases caused by secretion disorders);  
(thrombosis, cerebral hemorrhage and cerebral or peripheral nerve disorder)

[illegible]

代理人: 大家 邦久 (OHIE, Kunihisa); 〒103-0013 東京都中央区日本橋人形町2丁目2番6号煙口第2ビル7階 大家特許事務所 Tokyo (JP).

(81) 指定国(国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EG, EE, ES, FI, GN, GD, GE, GT, GM, GR, HU, IE, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KW, KZ, LA, LI, LT, LU, LV, MA, MD, ME, MK, MN, MW, MX, NZ, NI, NO, NZ, OM, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TR, TM, TN, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZR.

(84) 指定国(広域): ARIPO 特許(GU, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーロシア特許(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ユーロッパ特許(AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB,

[続表有]

**(S7) Abstract:** A compound of the general formula: (I) wherein the symbols are as defined in

[illegible]

（鏡寫有）

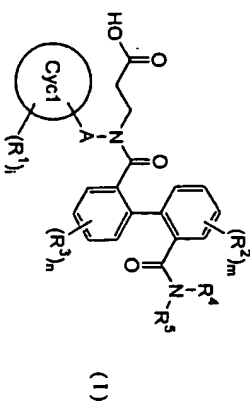
**WO 03/099765 A1**

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCJセットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

— 国际調查報告書 —

(57) 要約:

### 一般式(1)



(式中の記号は明細書記載通り。)で示される化合物、それらのプロダクト、それらの塩に関する。

一般式 (1) で示される化合物は、L P A 受容体に結合し拮抗するため、泌尿器系疾患 (前立腺肥大症または神経因性膀胱疾患に伴う症状、腎臓腫瘍、性間接ヘルニア、腎柱管狭窄症、糖尿病に起因する症状、下部尿路症 (例えば、下部尿路の閉塞性疾患など)、下部尿路の炎症性疾患、多尿)、癌関連疾患 (固形腫瘍、固形腫瘍転移、血管熱腫瘍、血管熱腫瘍、骨髄腫、多発性骨髄腫、カポジ肉腫、白血病、癌の浸潤転移)、増殖性疾患 (異常な血管新生を伴う疾患、動脈閉塞症、肺動脈症)、炎症・免疫系疾患 (乾眼、腎炎、肺炎、肺炎症)、分泌障害による疾患 (シェーグレン症候群) または癌関連疾患 (脳梗塞、脳出血、脳あるいは末梢神経障害) の予防および/または治療に有用である。

## 明 細 書

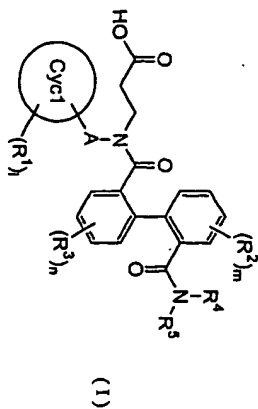
## β-アラニン誘導体およびその用途

## 5 技術分野

本発明は、医薬として有用なリソホスファチジン酸受容体（特に、EDG-2受容体）拮抗作用を有するβ-アラニン誘導体、その製造方法および用途に関する。

さらに詳しく言えば、本発明は、

## 10 (1) 一般式 (1)

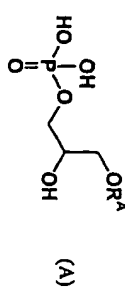


- (式中、すべての記号は後記と同じ意味を表わす。) で示されるβ-アラニン誘導体、それらのプロドラッグまたはそれらの非毒性塩、
- (2) それらの製造方法、および
- (3) それらを有効成分として含有する薬剤に関する。

## 背景技術

- 細胞膜からホスホオリパーゼの働きによりエイコサノイド、血小板活性化因子 (Platelet activating factor: PAF) など様々な脂質メディエーターが産生されることが知られている。

## 一般式 (A)



- (式中、R<sup>4</sup>はアシル基、アルケニル基またはアルキル基を表わす。) で示されるリソホスファチジン酸（以下、LPAと略記する。）は細胞膜より産生され、情報伝達物質として作用し、細胞内に様々なシグナルを伝えることのできる脂質である。その中で、天然に存在するLPAはL-α-LPAである。

- 最近3種のLPA受容体サタダイアの存在が明らかにになり、これらの生理作用がLPA受容体を介していることが、徐々に証明されてきている。3種のLPA受容体はEDG (Endothelial differentiation gene) -2、4、7と呼ばれており、スファインゴシン-1リン酸受容体のEDG-1、3、5、6、8と同様にEDG受容体ファミリーの一部を形成している。なお、EDG-2はLPA1、VZG (Ventricular zone gene) -1とも呼ばれている (Mol Pharmacol 2000 Dec; 58(6): 1188-96)。LPA受容体はLPAと結合し、同受容体にかつりつづけしたGタンパク質を介して細胞内にシグナルを伝える。LPA受容体に結合しうるGタンパク質としてはGs、Gi、Gqなどが知られており、同受容体は細胞増殖亢進作用、また逆の増殖抑制作用などの応答に関与するとされる。さらに、Gタンパク質の下流にはMAPキナーゼ系が運動しており、LPA受容体は多様なシグナルを伝達することが分かってきた。

- また、LPA受容体サタダイアは生体の広範囲に分布しているが、サタダイアによってそれらの局在様式が異なることから、それぞれの受容体の役割は組織により異なると考えられている。

5 LPAが惹起する薬理作用として、ラット血圧の上昇、ラット結腸および  
モルモット回腸の収縮現象などが知られている (J. Pharm. Pharmacol. 1991, 43,  
774, J. Pharm. Pharmacol. 1982, 34, 514)。また、WO02/062389 号明細書には、  
LPAがEDG-2を介して尿道の収縮に関与する旨が記載されており、  
5 WO03/007991 号明細書には、LPAが尿液の分泌を抑制する旨が記載されて  
いる。

その他、LPAと癌との関連性については、これまでにLPAが前立腺由  
来上皮癌細胞の増殖 (J. Cellular Physiol. 1998 174, 261)、卵巣癌細胞の増殖を  
促進させることなどが知られている (J. Urol. 2000, 163, 1027)。

10 また、癌細胞以外にもLPAが気道平滑筋細胞 (Am. J. Physiol. Lung Cell  
Mol. Physiol., 2002, 282(1): L91)、神経芽細胞 (Mol. Cell Biol., 1998, 18(12):  
7119)、メサンギウム細胞 (Clin. Science 1999, 96, 431)、肝細胞、肝スレ  
イト細胞 (Biochem. Biophys. Res. Commun., 1998, 248, 436)、血管平滑筋細胞  
(Am. J. Physiol., 1994, 267(Cell Physiol. 36): C204)、血管内皮細胞 (Am. J.  
15 Physiol. Cell Physiol., 2000, 278(3): C612)、グリア細胞/シュワン細胞 (Proc.  
Natl. Acad. Sci. USA, 1999, 96, 5233)、脂肪細胞 (J. Clin. Invest., 1998, 101, 1431)  
など様々な細胞増殖に関与することが知られている。また、細胞増殖以外に  
は癌細胞始めとして、炎症細胞の細胞遊走にLPAが関与することが知られ  
ている (Biochem Biophys Res Commun., 1993, 15:193(2), 497)。その他にはL  
20 P Aの免疫細胞の増殖・サイトカイン放出制御作用 (J. Immunol. 1999, 162,  
2049)、血小板凝集作用 (Biochem. Biophys. Res. Commun., 1981, 92, 391) が  
知られている。さらにはLPA受容体の一つであるEDG-2のノックアウ  
トマウスの解析から、EDG-2は脳の機能と関連することが分っている  
(Proc. Natl. Acad. Sci. USA, 2000, 97, 13384)。

25 これらのことから、LPA受容体に拮抗する薬剤は、種々の疾患、すなわ  
ち、泌尿器系疾患、癌関連疾患、増殖性疾患、炎症・免疫系疾患、分泌障害

による疾患または脳関連疾患などの予防および/または治療に有用であると  
考えられる。

5 泌尿器系疾患としては、例えば、前立腺肥大症または神経因性膀胱疾患に  
伴う症状 (排尿困難 (排尿開始遅延、排尿時間延長、尿線細小、間欠排尿、  
二段排尿など)、頻尿、夜間頻尿、排尿痛など)、脳血管障害、パーキンソ  
ン病、脳腫瘍、多発性硬化症、シャイートレーガー (Shy-Drager) 症、骨髄腫  
瘍、椎間板ヘルニア、脊管狭窄症、糖尿病などに起因する症状 (排尿困難  
10 (排尿開始遅延、排尿時間延長、尿線細小、間欠排尿、二段排尿など)、頻  
尿、夜間頻尿、排尿痛など)、下部尿路症 (例えば、下部尿路の閉塞疾患な  
ど)、下部尿路の炎症性疾患 (感染など)、多尿などが考えられる。

15 癌関連疾患としては、例えば、固形腫瘍、固形腫瘍転移、血管線維腫、骨  
髄腫、多発性骨髄腫、カボジ肉腫、白血病などが挙げられる。固形腫瘍の中  
には、乳癌、肺癌、胃癌、食道癌、結腸直腸癌、肝臓癌、卵巣癌、卵胞膜細  
胞腫、男性胚腫、頸部癌、子宮内臓癌、前立腺癌、腎臓癌、皮膚癌、骨肉腫、  
脾臓癌、尿路癌、甲状腺癌、脳腫瘍などが挙げられる。また、癌の浸潤転移  
もLPA受容体拮抗剤によって抑制されると考えられる。

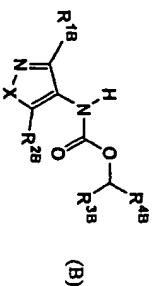
20 増殖性疾患としては、例えば、異常な血管新生を伴う疾患 (例えば、再  
狭窄、糖尿病性網膜症、血管新生性緑内障、後水晶体繊維増殖症、甲状腺過  
形成 (バセドウ病を含む)、肺炎症、ネフローゼ症候群、および骨粗しょう  
症)、動脈閉塞症、肺動脈症などが挙げられる。

25 炎症・免疫性疾患としては、例えば、乾癬、腎症 (例えば、IgA腎症な  
ど)、その他の炎症・免疫異常による胃炎、肝炎、肺炎症などが挙げられる。  
分泌障害による疾患としては、例えば、自律神経系異常による分泌障害等  
が挙げられ、自律神経系異常による分泌障害としては、例えば、シエーグレ  
ン (Sjogren) 症候群などが挙げられる。

脳関連疾患としては、例えば、脳梗塞、脳出血、脳あるいは末梢神経障害

などが挙げられる。

WO01/60819 号明細書には、一般式 (B)



[式中、 $R^{1B}$ は、置換基を有してもよい、アルキル基、アリール基、複素環式基、アルキルオキシ基、アリールオキシ基、アルキルチオ基、アリールチオ基、またはハロゲン原子を被われ、

$R^{2B}$ は、置換基を有してもよい、アルキル基、アリール基、複素環式基、アルキルオキシ基、アリールオキシ基、またはハロゲン化アルキル基を被われ、

$R^{3B}$ は、水素原子、低級アルキル基あるいはハロゲン化アルキル基を被われ、 $R^{4B}$ は、(a)置換基を有してもよい、フェニル基、アリール基、あるいは複素環式基、(b)置換基あるいは無置換のアルキル基、および(c)置換基あるいは無置換のアルケニル基からなる群から選択される基を被われ、

$X^B$ は酸素原子あるいは硫黄原子を被われ。但し、 $R^{3B}$ と $R^{4B}$ は、それらが結合している炭素原子と一緒に5～10員環構造を形成してもよく、また、 $R^{3B}$ が水素原子である場合、 $R^{4B}$ はメチル基を除く基を被われ。]

で示される化合物またはその塩が、LPA受容体拮抗作用を有することが記載されている。

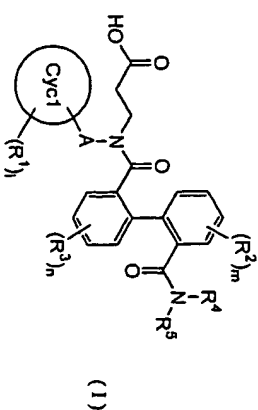
発明の開示

20 本発明者らは、LPA受容体に拮抗作用を示す化合物を見出すべく、鋭意研究した結果、一般式 (1) で示される  $\beta$ -アラニン誘導体が目的を達成することを発見し、本発明を完成した。

本発明は、LPA受容体に拮抗作用を示すことにより、種々の疾患治療薬となり得る。例えば、血圧に影響しない泌尿器系疾患等の予防およびまたは治療剤となる可能性がある新規な化合物を提供するものである。

5 本発明の一般式 (1) で示される  $\beta$ -アラニン誘導体は、これまで知られていない新規な化合物である。

本発明は、  
(1) 一般式 (1)。



[式中、Aは、

10 (1)C1～6アルキレン基、(2)C2～6アルケニレン基、または(3)C2～6アルキニレン基を被われ (ただし、Aは1～3個のC1～4アルキル基によって置換されてもよい。)、

(Cyc1) は、(1)C3～15の炭素環、または(2)1～4個の窒素原子、1～

15 2個の酸素原子および/または1～2個の硫黄原子を含む3～15員の複素環を被われ、

$R^1$ は、

(1)C1～4アルキル基、(2)ハロゲン原子、(3)シアノ基、(4)トリハロメチル基、(5)-OR<sup>6</sup>基、(6)-SR<sup>7</sup>基、(7)-NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>基、(8)ニトロ基、(9)-COOR<sup>10</sup>

基、(10)  $-\text{CONR}^{11}\text{R}^{12}$  基、(11)  $-\text{NR}^{13}\text{COR}^{14}$  基、(12)  $-\text{SO}_2\text{NR}^{15}\text{R}^{16}$  基、(13)  $-\text{NR}^{17}\text{SO}_2\text{R}^{18}$  基、(14)  $-\text{S}$  (O)  $\text{R}^{19}$  基、または(15)  $-\text{SO}_2\text{R}^{20}$  基を被わし、

$\text{R}^6, \text{R}^7, \text{R}^8, \text{R}^9, \text{R}^{10}, \text{R}^{11}, \text{R}^{12}, \text{R}^{13}, \text{R}^{14}, \text{R}^{15}, \text{R}^{16}, \text{R}^{17}, \text{R}^{18},$

5  $\text{R}^{19}$  および  $\text{R}^{20}$  は、それぞれ独立して、

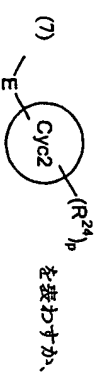
(1) 水素原子、または(2) C1～4アルキル基を被わし、

$\text{R}^{21}$  および  $\text{R}^{22}$  は、それぞれ独立して、

(1) C1～4アルキル基、(2) C1～4アルコキシ基、または(3) ハロゲン原子を被わし、

10  $\text{R}^{23}$  および  $\text{R}^{24}$  は、それぞれ独立して、

(1) 水素原子、(2) C1～4アルキル基、(3) C2～4アルケニル基、(4) C2～4アルキニル基、(5)  $-\text{OR}^{25}$  基によって置換された C1～4アルキル基、(6)  $-\text{NR}^{26}\text{R}^{27}$  基によって置換された C1～4アルキル基、または



15  $\text{R}^{28}$  と  $\text{R}^{29}$  はそれらが結合する置換原子と一緒に、3～15員の単環、二環式または三環式複素環 (ただし、該複素環は少なくとも一つの置換原子を含有し、 $-\text{OR}^{30}$  基によって置換された C1～4アルキル基によって置換されてもよい。) を被わし、

$\text{R}^{31}, \text{R}^{32}, \text{R}^{33}$  および  $\text{R}^{34}$  は、それぞれ独立して、

20 (1) 水素原子、(2) C1～4アルキル基、(3) C2～6アシル基、または(4) トリハロアセチル基を被わし、

E は、

(1) 単結合、(2) C1～6アルケニル基、(3) C2～6アルケニル基、または(4) C2～6アルキニル基を被わし (ただし、E は(1) C1～4アルキル基および

び(2)  $-\text{OR}^{35}$  から選択される 1～3 個の基によって置換された C1～4アルキル基によって置換されてもよい。)、

$\text{R}^{36}$  は、(1) 水素原子、(2) C1～4アルキル基、(3) C2～6アシル基、または

(4) トリハロアセチル基を被わし、

5  $\text{Cyc2}$  は、(1) C3～15の炭素環、または(2) 1～4 個の置換原子、1～

2 個の置換原子および/または 1～2 個の置換原子を含む 3～15 員の複素環を被わし、

$\text{R}^{37}$  は、

(1) C1～4アルキル基、(2) ハロゲン原子、(3) シアノ基、(4) トリハロメチル基、

10 (5)  $-\text{OR}^{38}$  基、(6)  $-\text{SR}^{39}$  基、(7)  $-\text{NR}^{40}\text{R}^{41}$  基、(8) エトロ基、(9)  $-\text{COOR}^{42}$  基、(10)  $-\text{CONR}^{43}\text{R}^{44}$  基、(11)  $-\text{NR}^{45}\text{COR}^{46}$  基、(12)  $-\text{SO}_2\text{NR}^{47}\text{R}^{48}$  基、(13)  $-\text{NR}^{49}\text{SO}_2\text{R}^{50}$  基、(14)  $-\text{S}$  (O)  $\text{R}^{51}$  基、または(15)  $-\text{SO}_2\text{R}^{52}$  基を被わし、

$\text{R}^{53}, \text{R}^{54}, \text{R}^{55}, \text{R}^{56}, \text{R}^{57}, \text{R}^{58}, \text{R}^{59}, \text{R}^{60}, \text{R}^{61}, \text{R}^{62}, \text{R}^{63}, \text{R}^{64}, \text{R}^{65}, \text{R}^{66}, \text{R}^{67}, \text{R}^{68}, \text{R}^{69},$

15  $\text{R}^{70}$  および  $\text{R}^{71}$  は、それぞれ独立して、

(1) 水素原子、または(2) C1～4アルキル基を被わし、

i は、0 または 1～5 の整数を被わし、

m は、0 または 1～4 の整数を被わし、

n は、0 または 1～4 の整数を被わし、

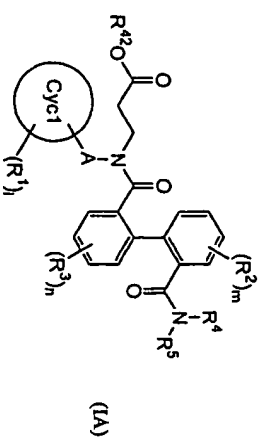
20 p は、0 または 1～5 の整数を被わす。

ただし、i が 2 以上を被わすとき、複数の  $\text{R}^{72}$  は各々同じでも異なってもよく、m が 2 以上を被わすとき、複数の  $\text{R}^{73}$  は各々同じでも異なってもよく、p が 2 以上を被わすとき、複数の  $\text{R}^{74}$  は各々同じでも異なってもよい。]

25 で示される β-アラニン誘導体、それらのプロドラッグまたはそれらの非導

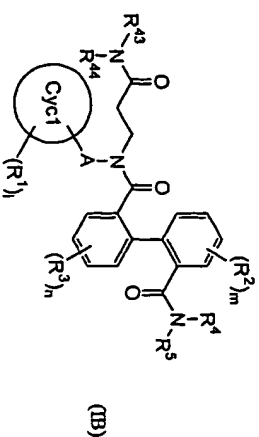
性塩、

(2) 一般式 (IA)



(式中、 $R^{2a}$ は、(1)C1～8アルキル基、または(2)1～2個の水酸基またはアミノ基によって置換されたC1～8アルキル基を表わし、その他の記号は前記(1)の記載と同じ意味を表わす。)で示される前記(1)記載のプロドラッグ、

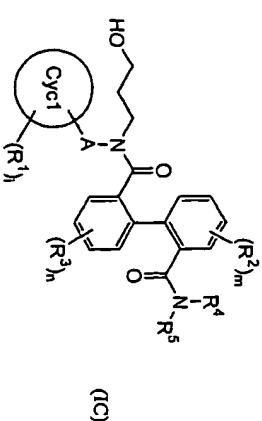
(3) 一般式 (IB)



10 (式中、 $R^{2a}$ および $R^{4a}$ は、それぞれ独立して、(1)水素原子、(2)C1～8アルキル基、または(3)1～2個の水酸基またはアミノ基によって置換されたC1～8アルキル基を表わし、その他の記号は前記(1)の記載と同じ意味を表わす。)で示される前記(1)記載のプロドラッグ、

(4) 一般式 (IC)

(式中、すべての記号は前記(1)の記載と同じ意味を表わす。)で示される前記(1)記載のプロドラッグ、



(5) 前記(1)記載の化合物、それらのプロドラッグまたはそれらの塩を含有する医薬組成物、

(6) LPA受容体拮抗剤である前記(5)記載の医薬組成物、

(7) LPA受容体がEDG-2受容体である前記(6)記載の医薬組成物、

(8) 泌尿器系疾患の予防および/または治療剤である前記(7)記載の医薬組成物、

10 (9) 癌関連疾患、増殖性疾患、炎症・免疫系疾患、分泌障害による疾患、

脳関連疾患の予防および/または治療剤である前記(7)記載の医薬組成物、

(10) 前記(1)記載の化合物、それらのプロドラッグまたはそれらの塩の有効量を哺乳動物に投与することと特徴とする哺乳動物におけるEDG-2に起因する疾患の予防および/または治療方法、

15 (11) EDG-2に起因する疾患が、泌尿器系疾患である前記(10)記載の予防および/または治療方法、

(12) EDG-2に起因する疾患が、癌関連疾患、増殖性疾患、炎症・免疫系疾患、分泌障害による疾患、脳関連疾患である前記(10)記載の予防および/または治療方法、

20 (13) EDG-2に起因する疾患の予防または治療剤を製造するための前

配 (1) 配載の化合物、それらのプロドラッグまたはそれらの塩の使用、

(14) EDG-2に起因する疾患が、泌尿器系疾患である前配 (13) 配載の使用、

5 (15) EDG-2に起因する疾患が、精関連疾患、増殖性疾患、炎症・免疫系疾患、分泌障害による疾患、脳関連疾患である前配 (13) 配載の使用、

(16) 前配 (1) 配載の化合物、それらのプロドラッグまたはそれらの塩を有効成分とするLPA受容体拮抗剤と、他のLPA受容体拮抗剤、 $\alpha 1$ 遮断剤、抗コリン剤、5 $\alpha$ -リダクターゼ阻害剤、および/または抗アン드로ゲン剤から選ばれる1種または2種以上の剤を組み合わせてなる泌尿器系疾患の予防および/または治療剤、および

10 (17) 前配 (1) 配載の化合物、それらのプロドラッグまたはそれらの塩の製造方法に関する。

#### 詳細な説明

15 本明細書中、C1~4アルキル基とは、メチル、エチル、プロピル、ブチル基およびそれらの異性体である。

本明細書中、C1~8アルキル基とは、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヘプタチル、オクタチル基およびそれらの異性体である。

20 本明細書中、C2~4アルケニル基とは、エタニル、プロペニル、ブタニル基およびそれらの異性体である。

本明細書中、C2~4アルキニル基とは、エチニル、プロピニル、ブチニル基およびそれらの異性体である。

25 本明細書中、C1~4アルコキシ基とは、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、ブトキシ基およびそれらの異性体である。

本明細書中、C1~6アルキレン基とは、メチレン、エチレン、トリメチ

レン、テトラメチレン、ペンタメチレン、ヘキサメチレン基およびそれらの異性体である。

本明細書中、C2~6アルケニレン基とは、エタニレン、プロペニレン、ブタニレン、ペンタニレン、ヘキセニレン基およびそれらの異性体である。

5 本明細書中、C2~6アルキニレン基とは、エチニレン、プロピニレン、ブチニレン、ペンチニレン、ヘキシニレン基およびそれらの異性体である。

本明細書中、C2~6アシル基とは、エタノイル、プロパノイル、ブタノイル、ペンタノイル、ヘキサノイル基およびそれらの異性体である。

10 本明細書中、ハロゲン原子とはフッ素、塩素、臭素、ヨウ素原子を意味する。

本明細書中、トリハロメチル基とは、3個のハロゲン原子で置換されたメチル基を意味し、例えば、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、トリブロモメチル、トリヨードメチル基が挙げられる。

15 本明細書中、トリハロアセチル基とは、3個のハロゲン原子で置換されたアセチル基を意味し、例えば、トリフルオロアセチル、トリクロロアセチル、トリブロモアセチル、トリヨードアセチル基が挙げられる。

本明細書中で用いるC3~15の炭素環には、C3~15の単環、二環または三環式不飽和炭素環、その一部または全部が飽和されている炭素環、ス

20 シクロロバン、シクロブタン、シクロペンタン、シクロヘキサン、シクロヘプタン、シクロオクタン、シクロノナン、シクロデカン、シクロウンデカン、シクロドデカン、シクロトリデカン、シクロテトラデカン、シクロペンタデカン、シクロヘンテデカン、シクロヘキセン、シクロヘプテン、シクロオクタデカン、シクロヘンタジエン、シクロヘキサジエン、シクロヘプタジエン、シクロオクタジエン、ベンゼン、ベンタレン、バーヒドロベンタレン、アズ

25 レン、バーヒドロアズレン、インデン、バーヒドロインデン、インダン、ナ

フタレン、ジヒドロナフタレン、テトラヒドロナフタレン、バネヒドロナ  
 フタレン、ヘキサレン、バネヒドロヘキサレン、ピラセン、*as*-イソピ  
 ラセン、*sa*-イソピラセン、アセナフチレン、アセナフチン、フルオレン、フエ  
 ナレン、フエチンソレン、アノトラセン、ヌピロ [4. 4] ノナン、ヌピロ  
 [4. 5] デカリン、ヌピロ [5. 5] クンデカリン、ピシクロ [2. 2. 1]  
 ヘキサリン、ピシクロ [2. 2. 1] ヘプタ-2-エン、ピシクロ [3. 1.  
 1] ヘプタリン、ピシクロ [3. 1. 1] ヘプタ-2-エン、ピシクロ [2.  
 2. 2] オクタリン、ピシクロ [2. 2. 2] オクタ-2-エン、アヂマンタ  
 リン、ノルアダマンタリン等が挙げられる。

- 10 本明細書中で用いる1〜4個の置換原子、1〜2個の酸素原子および/または1〜2個の硫黄原子を含む3〜15員の複素環には、1〜4個の置換原子、1〜2個の酸素原子および/または1〜2個の硫黄原子から選択されるヘテロ原子を含む、3〜15員の単環、二環または三環式不飽和複素環、およびその一部または全部が飽和されている複素環が含まれる。例えば、ピロール、イミダゾール、トリアゾール、テトラゾール、ピラゾール、ピリジン、ピラジン、ピリミジン、ピリダジン、アゼピン、ジアゼピン、フラン、ピラジン、オキセピン、チオアエン、チオピラン、チエピン、オキサゾール、イソオキサゾール、チアゾール、イソチアゾール、フラザン、オキサジアゾール、オキサジン、オキサジアジン、オキサゼピン、オキサジアゼピン、チアジアゾール、チアジン、チアジアジン、チアゼピン、チアジアゼピン、インドール、イソインドール、インドリジン、ベンゾフラン、イソベンゾフラン、ベンゾチオアエン、イソベンゾチオアエン、ジチアチアタレン、インドナール、キノリン、イソキノリン、キノリジン、フリリン、フタラジン、フチリジン、ナフチリジン、キノキサリン、キサノリン、シンノリン、ベンゾオキサゾール、ベンゾチアゾール、ベンゾイミダゾール、クロメン、ベンゾオキセピン、ベンゾオキサゼピン、ベンゾオキサジアゼピン、ベンゾチエピン、ベンゾチ

アセビシ、ベシソチアジアセビシ、ベシソアセビシ、ベシソジアセビシ、ベ  
 シソアラザシ、ベシソチアアソール、ベシソトリアソール、カルバソール、  
 ベーカルボリシ、アクリジシ、アエサジシ、ジベシソアラシ、キサシチシ、  
 ジベシソチアアソール、アエノチアジシ、アエノキサチアソ、アエノ  
 チアソスベシ、アエサソトリシ、アエサソトリシ、ベリミシシ、アジリ  
 ジシ、アセチジシ、ベロリシ、ベロリジシ、イミダソリシ、イミダソリジシ、  
 トリアソリシ、トリアソリジシ、チトラソリシ、チトラソリジシ、ベラソリ  
 シ、ベラソリジシ、ジベシロベリジシ、チトラヒベロベリジシ、ベベリジシ、  
 ジベシロベラジシ、チトラヒベロベラジシ、ベベラジシ、ジベシロベリミジ  
 シ、チトラヒベロベリミジシ、ベベヒベロベリミジシ、ジベシロベリダジシ、  
 チトラヒベロベリダジシ、ベベヒベロベリダジシ、ジベシロベラセビシ、チト  
 ラヒベロアセビシ、ベベヒベロアセビシ、ジベシロジアセビシ、チトラヒベ  
 ロジアセビシ、ベベヒベロジアセビシ、オキシシシ、オキシセシシ、ジベシロ  
 フラシ、チトラヒベロフラシ、ジベシロベラシ、チトラヒベロベラシ、ジベ  
 シロオキシセビシ、チトラヒベロオキシセビシ、ベベヒベロオキシセビシ、チイラ  
 シ、チエタシ、ジベシロチオアソシ、チトラヒベロチオアソシ、ジベシロチ  
 オベラシ、チトラヒベロチオベラシ、ジベシロチエビシ、チトラヒベロチエ  
 ビシ、ベベヒベロチエビシ、ジベシロオキシソール、チトラヒベロオキシソ  
 ール（オキシソソリシシ）、ジベシロイソオキシソール、チトラヒベロイソオ  
 キサソール（イソオキシソソリシシ）、ジベシロチアソール、チトラヒベロチ  
 アソール（チアソソリシシ）、ジベシロイソチアソール、チトラヒベロイソチ  
 アソール（イソチアソソリシシ）、ジベシロアラシ、チトラヒベロアラシ、  
 ジベシロオキシサジソール、チトラヒベロオキシサジソール（オキシサジソ  
 リシシ）、ジベシロオキシサジシ、チトラヒベロオキシサジシ、ジベシロオキシ  
 サジシ、チトラヒベロオキシサジシ、ジベシロオキシセビシ、チトラヒ  
 ベロオキシセビシ、ベベヒベロオキシセビシ、ジベシロオキシサジセビシ、






テトラヒドロオキサジアゼピン、バーヒドロオキサジアゼピン、ジヒドロ  
 アジアソール、テトラヒドロチアジアソール (チアジアソリジン)、ジヒ  
 ロチアジン、テトラヒドロチアジン、ジヒドロチアジン、テトラヒドロ  
 チアジアジン、ジヒドロチアゼピン、テトラヒドロチアゼピン、バーヒドロ  
 チアゼピン、ジヒドロチアゼピン、テトラヒドロチアゼピン、バー  
 ヒドロチアゼピン、モルホリン、チオモルホリン、オキサチアテン、イン  
 ドリン、イソインドリン、ジヒドロベンゾフラン、バーヒドロベンゾフラン、  
 ジヒドロイソベンゾフラン、バーヒドロイソベンゾフラン、ジヒドロベン  
 チオアエン、バーヒドロベンゾチオアエン、ジヒドロイソベンゾチオアエン、  
 10 バーヒドロイソベンゾチオアエン、ジヒドロインダノール、バーヒドロイン  
 ダノール、ジヒドロキノリン、テトラヒドロキノリン、バーヒドロキノリ  
 ン、ジヒドロイソキノリン、テトラヒドロイソキノリン、バーヒドロイソキノリ  
 ン、ジヒドロフタラジン、テトラヒドロフタラジン、バーヒドロフタラジン、  
 ジヒドロナフチリジン、テトラヒドロナフチリジン、バーヒドロナフチリジ  
 ン、ジヒドロキノキサリン、テトラヒドロキノキサリン、バーヒドロキノキ  
 15 サリン、ジヒドロキナノリン、テトラヒドロキナノリン、バーヒドロキナノ  
 リン、ジヒドロシンノリン、テトラヒドロシンノリン、バーヒドロシンノリ  
 ン、ベンゾオキサチアテン、ジヒドロベンゾオキサチアジン、ジヒドロベンゾチア  
 ジン、ピラジノモルホリン、ジヒドロベンゾオキサソール、バーヒドロベン  
 20 ソオキサソール、ジヒドロベンゾチアソール、バーヒドロベンゾチアソール、  
 ジヒドロベンゾイミダノール、バーヒドロベンゾイミダノール、ジヒドロベ  
 ンゾアゼピン、テトラヒドロベンゾアゼピン、ジヒドロベンゾジアゼピン、  
 テトラヒドロベンゾジアゼピン、ベンゾジオキセパン、ジヒドロベンゾオキ  
 サゼピン、テトラヒドロベンゾオキサゼピン、ジヒドロカルバソール、テト  
 25 ラヒドロカルバソール、バーヒドロカルバソール、ジヒドロアクリジン、テ  
 トラヒドロアクリジン、バーヒドロアクリジン、ジヒドロジベンゾフラン、

ジヒドロジベンゾチオアエン、テトラヒドロジベンゾフラン、テトラヒドロ  
 ジベンゾチオアエン、バーヒドロジベンゾフラン、バーヒドロジベンゾチオ  
 アエン、ジオキノラン、ジオキサソ、ジチオラン、ジチアソ、ジオキサイン  
 ダン、ベンゾジオキサソ、クロアソ、ベンゾジチオアソ、ベンゾジチアソ環  
 5 等が挙げられる。  
 本明細書中、R<sup>1</sup>とR<sup>2</sup>が結合する置換原子と一緒にあって数わす3〜15員  
 の単環、二環式または三環式複素環には、少なくとも一つの置換原子を含む、  
 3〜15員の単環、二環または三環式不飽和複素環、およびその一部または  
 全部が飽和されている複素環が含まれる。例えば、ピロール、イミダノール、  
 10 トリアソール、テトラソール、ピラノール、インドール、イソインドール、  
 インダノール、フリソ、ベンゾイミダノール、ベンゾアゼピン、ベンゾジア  
 ゼピン、ベンゾトリアノール、カルバノール、 $\beta$ -カルボリン、1, 2, 3,  
 4-テトラヒドロ- $\beta$ -カルボリン、フエノチアジン、フエノキサジン、ペ  
 リミジン、アジリジン、アゼチジン、ピロリン、ピロリジン、イミダノリン、  
 15 イミダノリジン、トリアノリン、トリアソリジン、テトラノリン、テトラソ  
 リジン、ピラノリン、ピラソリジン、ジヒドロピリジン、テトラヒドロピリ  
 ジン、ピペリジン、ジヒドロピラジン、テトラヒドロピラジン、ピペラジン、  
 ジヒドロピリミジン、テトラヒドロピリミジン、バーヒドロピリミジン、ジ  
 ヒドロピリダジン、テトラヒドロピリダジン、バーヒドロピリダジン、ジヒ  
 20 ドロアゼピン、テトラヒドロアゼピン、バーヒドロアゼピン、ジヒドロジア  
 ゼピン、テトラヒドロジアゼピン、バーヒドロジアゼピン、テトラヒドロオ  
 キサノール (オキサソリジン)、テトラヒドロイソオキサノール (イソオキ  
 サソリジン)、テトラヒドロチアノール (チアソリジン)、テトラヒドロイ  
 ソチアノール (イソチアソリジン)、ジヒドロフラザン、テトラヒドロフラ  
 25 ザン、ジヒドロオキサジアノール、テトラヒドロオキサジアソール (オキサ  
 ジアソリジン)、テトラヒドロオキサジン、ジヒドロオキサジアジン、テト

- ラヒドロオキシアジアジン、バーヒドロオキサゼピン、テトラヒドロオキサジアゼピン、バーヒドロオキサジアゼピン、ジヒドロチアジアゾール、テトラヒドロチアジアゾール(チアジアソリジン)、テトラヒドロチアジン、ジヒドロチアジアジン、テトラヒドロチアジアジン、バーヒドロチアゼピン、テトラヒドロチアジアゼピン、バーヒドロチアジアゼピン、モルホリン、チオモルホリン、インブリン、インインブリン、ジヒドロインダノール、バーヒドロインダノール、ジヒドロキノリン、テトラヒドロキノリン、バーヒドロキノリン、ジヒドロイソキノリン、テトラヒドロイソキノリン、バーヒドロイソキノリン、ジヒドロフタラジン、テトラヒドロフタラジン、バーヒドロフタラジン、ジヒドロナフチリジン、テトラヒドロナフチリジン、バーヒドロナフチリジン、ジヒドロキノキサリン、テトラヒドロキノキサリン、バーヒドロキノキサリン、ジヒドロキナゾリン、テトラヒドロキナゾリン、バーヒドロシノリン、ジヒドロベンゾオキサジン、ジヒドロベンゾチアジン、ピラジノモルホリン、ジヒドロベンゾオキサゾール、バーヒドロベンゾオキサゾール、ジヒドロベンゾチアゾール、バーヒドロベンゾチアゾール、ジヒドロベンゾイミダゾール、バーヒドロベンゾイミダゾール、ジヒドロベンゾアゼピン、テトラヒドロベンゾアゼピン、ジヒドロベンゾジアゼピン、テトラヒドロベンゾジアゼピン、ジヒドロカルバゾール、テトラヒドロカルバゾール、バーヒドロカルバゾール、ジヒドロアクリジン、バーヒドロアクリジン環等が挙げられる。

- 20 本発明においては、特に指示しない限り異性体はこれをすべて包含する。例えば、アルキル基、アルケニル基、アルキニル基、アルコキシ基、アルキレン基、アルケニレン基およびアルキニレン基には置換のものおよび分枝鎖のものが含まれる。さらに、二重結合、環、縮合環における異性体(E、Z、シス、トランス体)、不斉炭素の存在等による異性体(R、S体、 $\alpha$ 、 $\beta$ 体、

エンナンチオマー、ジアステレオマー)、旋光性を有する光学活性体(D、L、d、l体)、クロマトグラフ分離による極性体(高極性体、低極性体)、平衡化合物、回転異性体、これらの任意の割合の混合物、ラセミ混合物は、すべて本発明に含まれる。

- 5 本発明においては、特に断わらない限り、当業者にとって明らかなように記号  は紙面の向こう側(すなわち $\alpha$ -配置)に結合していることを表わし、 は紙面の手前側(すなわち $\beta$ -配置)に結合していることを表わし、 は、 $\alpha$ -配置と $\beta$ -配置の混合物であることを表わす。

- 10 本発明化合物は、公知の方法で非毒性塩に変換される。  
非毒性塩は薬学的に許容される水溶性のものが好ましい。

- 本発明化合物の非毒性塩としては、例えば、アルカリ金属(カリウム、ナトリウム、リチウム等)の塩、アルカリ土類金属(カルシウム、マグネシウム等)の塩、アンモニウム塩(テトラメチルアンモニウム塩、テトラブチルアンモニウム塩等)、有機アミン(トリエチルアミン、メチルアミン、ジメチルアミン、シクロペンチルアミン、ベンジルアミン、フェニルアミン、ピペリジン、モリエタノールアミン、ジエタノールアミン、トリス(ヒドロキシメチル)メチルアミン、リジン、アルギニン、N-メチル-D-グルカミン等)の塩、酸付加物塩(無機酸塩(塩酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素酸塩、硫酸塩、リン酸塩、硝酸塩等)、有機酸塩(酢酸塩、トリフルオロ酢酸塩、乳酸塩、酒石酸塩、シュウ酸塩、マレイン酸塩、安息香酸塩、クエン酸塩、メタンスルホン酸塩、エタンスルホン酸塩、ペンゼンスルホン酸塩、トルエンスルホン酸塩、イセチオン酸塩、グルクロン酸塩、グルコン酸塩等)等)が挙げられる。

- 25 本発明化合物の非毒性塩には、溶媒和物、または上記本発明化合物のアルカリ(土類)金属塩、アンモニウム塩、有機アミン塩、酸付加物塩の溶媒和物も含まれる。

溶媒和物は非環性かつ水溶性であることが好ましい。適当な溶媒和物としては、例えば水、アルコール系溶媒（エタノール等）等の溶媒和物が挙げられる。


5 本発明のプロドラッグは特に限定されないが、生物学的利用率および生体膜透過性の改善されるものが好ましい。本発明の一般式（I）で示される化合物は、カルボキシシル基を有するため、生体内で切断され、カルボキシシル基に変換されるものまたは生体内で酸化され、カルボキシシル基に変換されるものが挙げられる。

10 生体内で切断され、カルボキシシル基に変換されるものとしては、例えば、一般式（IA）で示されるカルボン酸エステル誘導体、または一般式（IB）で示されるカルボン酸アミド誘導体が挙げられる。

生体内で酸化され、カルボキシシル基に変換されるものとしては、例えば、一般式（IC）で示されるアルコール誘導体が挙げられる。

15 一般式（I）中、Aとして好ましくは、C1～6アルキレン基であり、より好ましくはメチレン、エチレン、トリメチレン、またはテトラメチレン基である。

一般式（I）中、

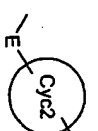
 Cyc1 として好ましくは、C5～10の炭素環、または1～4個の窒素

20 原子、1～2個の酸素原子および/または1～2個の硫黄原子を含む5～10員の複素環であり、より好ましくは、ベンゼン、ナフタレン、テトラヒドロナフタレン、インデン、シクロヘキサン、ピリジン、ピペリジン、キノリン、テトラヒドロキノリン、ピロール、ピロリジン、インドール、インドリン、フラン、ベンゾフラン、チオフラン、またはベンゾチオフラン環である。一般式（I）中、R<sup>1</sup>として好ましくは、C1～4アルキル基、ハロゲン原

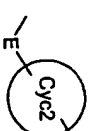
子、-OR<sup>6</sup>基、-SR<sup>7</sup>基、-NR<sup>8</sup>R<sup>8</sup>基、ニトロ基、-COOR<sup>10</sup>基、-CONR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>基、-NR<sup>13</sup>COR<sup>14</sup>基、-SO<sub>2</sub>NR<sup>15</sup>R<sup>16</sup>基、または-NR<sup>17</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>18</sup>基であり、より好ましくは、メチル基、エチル基、プロピル基、ブチル基、フッ素原子、塩素原子、水酸基、メトキシ基、エトキシ基、プロボキシ基、アミノスルホニル基、またはジメチルアミノスルホニル基である。

5 一般式（I）中、R<sup>2</sup>およびR<sup>3</sup>として好ましくは、C1～4アルキル基、またはC1～4アルコキシ基である。

10 一般式（I）中、R<sup>4</sup>およびR<sup>5</sup>として好ましくは、水素原子、C1～4アルキル基、C2～4アルケニル基、-OR<sup>21</sup>基によって置換されたC1～4アルキル基、-NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>基によって置換されたC1～4アルキル基、または

 であり、より好ましくは、水素原子、C1～4アルキ

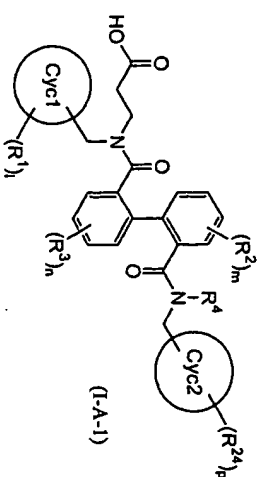
ル基、アリール基、ヒドロキシメチル基、2-ヒドロキシエチル基、2-（ジメチルアミノ）エチル基、または

 である。

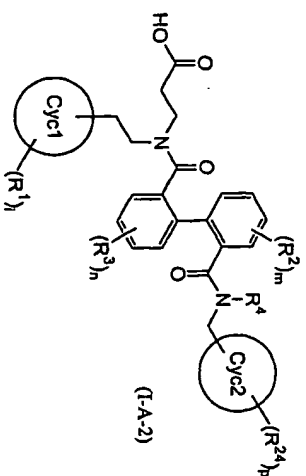
15 一般式（I）中、R<sup>4</sup>とR<sup>5</sup>が結合する窒素原子と一緒になって接合する3～15員の単環、二環式または三環式複素環として好ましくは、アジリジン、アゼチジン、ピロリン、ピロリジン、イミダゾリン、イミダゾリジン、ピラゾリン、ピラゾリジン、ジヒドロピリジン、テトラヒドロピリジン、ピペリジン、ジヒドロピラジン、テトラヒドロピラジン、ピペラジン、ジヒドロピリミジン、テトラヒドロピリミジン、パーヒドロピリミジン、ジヒドロピリダジン、テトラヒドロピリダジン、パーヒドロピリダジン、ジヒドロアゼピン、テトラヒドロアゼピン、パーヒドロアゼピン、ジヒドロジアゼピン、テトラヒドロジアゼピン、パーヒドロジアゼピン、テトラヒドロオキサゾール（オ

- キサンリジン)、テトラヒドロイソオキサゾール (イソオキサゾリジン)、  
 テトラヒドロチアゾール (チアゾリジン)、テトラヒドロイソチアゾール (イ  
 ソチアゾリジン)、テトラヒドロオキサジン、バーヒドロオキサゼピン、チ  
 トラヒドロチアジン、バーヒドロチアゼピン、モルホリン、チオモルホリン、  
 イソブリン、イソイソブリン、ジヒドロイソダゾール、バーヒドロイソダゾ  
 ール、ジヒドロキノリン、テトラヒドロキノリン、バーヒドロキノリン、ジ  
 ヒドロイソキノリン、テトラヒドロイソキノリン、バーヒドロイソキノリン、  
 ジヒドロフタラジン、テトラヒドロフタラジン、バーヒドロフタラジン、ジ  
 ヒドロナフチリジン、テトラヒドロナフチリジン、バーヒドロナフチリジン、  
 ジヒドロキノキサリン、テトラヒドロキノキサリン、バーヒドロキノキサリ  
 ン、ジヒドロキサンリン、テトラヒドロキサンリン、バーヒドロキサンリン、  
 ジヒドロシノリン、テトラヒドロシノリン、バーヒドロシノリン、ジ  
 ヒドロベンゾオキサジン、ジヒドロベンゾチアジン、ジヒドロベンゾオキサ  
 ノール、バーヒドロベンゾオキサノール、ジヒドロベンゾチアノール、バー  
 ヒドロベンゾチアノール、ジヒドロベンゾイミダノール、バーヒドロベンゾ  
 イミダノール、ジヒドロベンゾアゼピン、テトラヒドロベンゾアゼピン、ジ  
 ヒドロベンゾジアゼピン、テトラヒドロベンゾジアゼピン、テトラヒドロベ  
 ンゾオキサゼピン、ジヒドロカルバノール、テトラヒドロカルバノール、バ  
 ーヒドロカルバノール、ジヒドロタリジン、バーヒドロアタリジン、カル  
 バノール、 $\beta$ -カルボリン、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ- $\beta$ -カルボリ  
 ン、フェノチアジン、フェノキサジン環である。  
 一般式 (1) 中、Eとして好ましくは、C1~6アルキレン基、またはC  
 2~6アルケニレン基であり、より好ましくは、メチレン、エチレン、トリ  
 メチレン、またはテトラメチレン基である。  
 一般式 (1) 中、

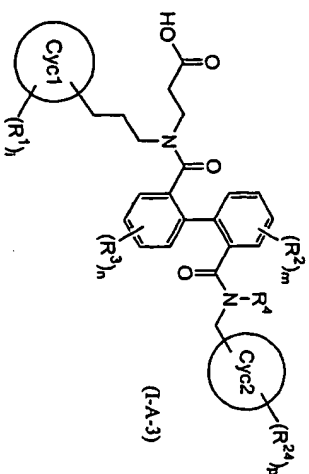
- Cyc2 として好ましくは、C5~10の炭素環、または1~4個の窒素  
 原子、1~2個の酸素原子および/または1~2個の硫黄原子を含む5~1  
 0員の複素環であり、より好ましくは、ベンゼン、ナフタレン、テトラヒド  
 ロナフタレン、イソデリン、シクロヘキサン、ピリジン、ピペリジン、キノリ  
 ン、テトラヒドロキノリン、ピロール、ピロリジン、インドール、インドリ  
 ン、フラン、ベンゾフラン、チオフエン、またはベンゾチオフエン環である。  
 一般式 (1) 中、R<sup>24</sup>として好ましくは、C1~4アルキル基、ハロゲン原  
 子、-OR<sup>27</sup>基、-SR<sup>28</sup>基、-NR<sup>29</sup>R<sup>30</sup>基、ニトロ基、-COOR<sup>31</sup>基、-  
 CONR<sup>32</sup>R<sup>33</sup>基、-NR<sup>34</sup>COR<sup>35</sup>基、-SO<sub>2</sub>NR<sup>36</sup>R<sup>37</sup>基、または-NR<sup>3</sup>  
 SO<sub>2</sub>R<sup>38</sup>基であり、より好ましくは、メチル基、エチル基、プロピル基、ブ  
 チル基、フッ素原子、塩素原子、水酸基、メトキシ基、エトキシ基、プロポ  
 キシ基、アミノスルホニル基、またはジメチルアミノスルホニル基である。  
 iとして好ましくは0または1~3の整数である。  
 mとして好ましくは0または1~2の整数である。  
 nとして好ましくは0または1~2の整数である。  
 pとして好ましくは0または1~3の整数である。  
 一般式 (1) で示される化合物のうち、好ましい化合物としては、  
 一般式 (I-A-1)



(式中、すべての記号は前記と同じ意味を表わす。) で示される化合物、  
一般式 (1-A-2)

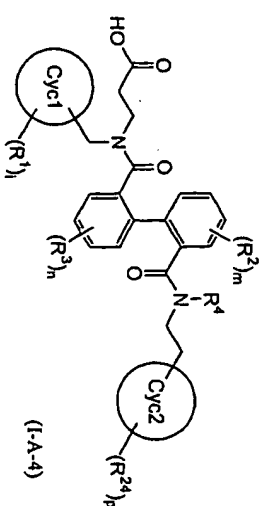


(式中、すべての記号は前記と同じ意味を表わす。) で示される化合物、  
一般式 (1-A-3)

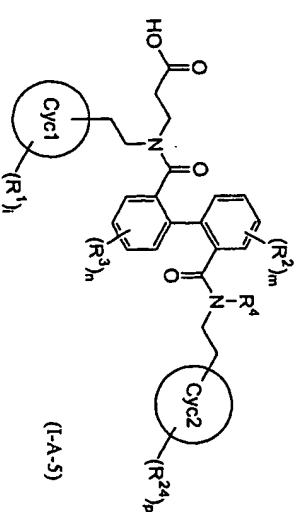


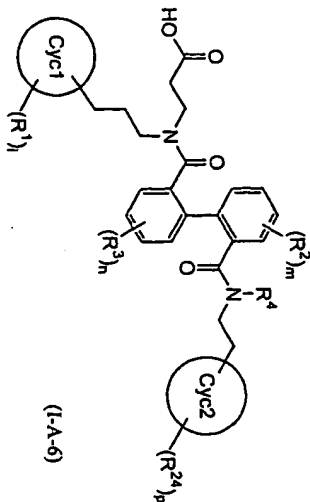
(式中、すべての記号は前記と同じ意味を表わす。) で示される化合物、  
一般式 (1-A-4)

(式中、すべての記号は前記と同じ意味を表わす。) で示される化合物、  
一般式 (1-A-5)



(式中、すべての記号は前記と同じ意味を表わす。) で示される化合物、  
一般式 (1-A-6)





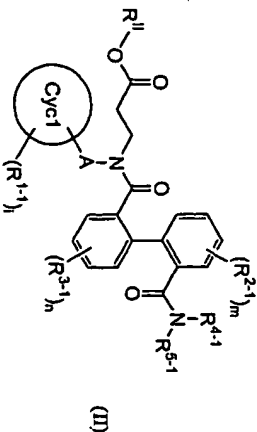
(式中、すべての記号は前記と同じ意味を表わす。) で示される化合物、これらのプロドラッグまたはそれらの非毒性塩が挙げられる。

本発明の具体的な化合物としては、実施例に記載した化合物、それらのプロドラッグまたはそれらの非毒性塩が挙げられる。

# [本発明化合物の製造方法]

一般式 (I) 、一般式 (IA) 、一般式 (IB) 、および一般式 (IC) で示される本発明化合物は、以下に示す方法または実施例に示す方法に従って製造することができる。

10 一般式 (I) で示される化合物は、一般式 (II)



(式中、R<sup>1</sup>はカルボキシ基の保護基を表わし、R<sup>1-1</sup>、R<sup>2-1</sup>、R<sup>3-1</sup>、R<sup>4-1</sup>、およびR<sup>5-1</sup>は、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、およびR<sup>5</sup>と同じ意味を表わすが、R<sup>1-1</sup>、

R<sup>2-1</sup>、R<sup>3-1</sup>、R<sup>4-1</sup>、およびR<sup>5-1</sup>によって表わされる基に含まれる水酸基、アミノ基またはチオール基は保護が必要な場合には保護されているものとする。その他の記号は前記と同じ意味を表わす。) で示される化合物をカルボキシ基の保護基の脱保護反応に付し、さらに必要に応じて保護基の脱保護反応に付すことにより製造することができる。

カルボキシ基の保護基としては、例えばメチル基、エチル基、アリル基、t-ブチル基、トリクロエチル基、ベンジル (Bn) 基、フェニル基、p-メトキシベンジル基、トリチル基、2-クロロトリチル基またはそれらの構造が結合した固相担体等が挙げられる。

10 カルボキシ基の保護基の脱保護反応はよく知られており、例えば、

- (1) アルカリ加水分解、
- (2) 酸性条件下における脱保護反応、
- (3) 加水分解による脱保護反応、
- (4) 金属を用いた脱保護反応、
- (5) 有機金属を用いた脱保護反応等が挙げられる。

15 これらの方法を具体的に説明すると、

(1) アルカリ加水分解による脱保護反応は、例えば、有機溶媒 (メタノール、テトラヒドロフラン、ジオキサン等) 中、アルカリ金属の水酸化物 (水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化リチウム等) 、アルカリ土類金属の水酸化物 (水酸化バリウム、水酸化カルシウム等) または炭酸塩 (炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等) あるいはその水溶液もしくはこれらの混合物を用いて、0~40℃の温度で行なわれる。

(2) 酸条件下での脱保護反応は、例えば、有機溶媒 (ジクロロメタン、クロロホルム、ジオキサン、酢酸エチル、アニソール等) 中、有機酸 (酢酸、トリフルオロ酢酸、メタンスルホン酸、p-トリチル酸等) 、または無機酸 (塩酸、硫酸等) もしくはこれらの混合物 (臭化水素/酢酸等) 中、0~100℃

の温度で行なわれる。

- (3) 加水分解による脱保護反応は、例えば、溶媒（エーテル系（テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチルエーテル等）、アルコール系（メタノール、エタノール等）、ベンゼン系（ベンゼン、トルエン等）、ケトン系（アセトン、メチルエチルケトン等）、ニトリル系（アセトニトリル等）、アミド系（ジメチルホルムアミド等）、水、酢酸エチル、酢酸またはそれらの2以上の混合溶媒等）中、触媒（パラジウム炭素、パラジウム黒、水酸化パラジウム、酸化白金、ラネニッケル等）の存在下、常圧または加圧下の水素雰囲気下または希酸アンモニウム存在下、0〜20℃の温度で行なわれる。

- (4) 金属を用いた脱保護反応は、例えば、酸性溶媒（酢酸、pH4.2〜7.2の緩衝液またはそれらの溶液とテトラヒドロフラン等の有機溶媒との混合液）中、粉末亜鉛の存在下、超音波をかけるかまたは超音波をかけないで、0〜40℃の温度で行なわれる。

- (5) 金属錯体を用いる脱保護反応は、例えば、有機溶媒（ジクロロメタン、ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン、酢酸エチル、アセトニトリル、ジオキサン、エタノール等）、水またはそれらの混合溶媒中、トラップ試薬（水酸化トリチルルス、トリエチルシラン、ジメトン、モルホリン、ジエチルアミン、ピロリジン等）、有機酸（酢酸、ギ酸、2-エチルヘキサン酸等）および/または有機酸塩（2-エチルヘキサン酸ナトリウム、2-エチルヘキサン酸カリウム等）の存在下、ホスフィン系試薬（トリフェニルホスフィン等）の存在下または非存在下、金属錯体（テトラキストリフェニルホスフィンパラジウム(0)、二塩化ビス（トリフェニルホスフィン）パラジウム(II)、酢酸パラジウム(II)、塩化トリス（トリフェニルホスフィン）ロジウム(1)等）を用いて、0〜40℃の温度で行なわれる。

また、上記以外にも、例えば、T. W. Greene, *Protective Groups in Organic*

*Synthesis*, Wiley, New York, 1999 に記載された方法によって、脱保護反応を行なうことができる。

当業者には容易に理解できることではあるが、これらの脱保護反応を使い分けることにより、目的とする本発明化合物が容易に製造することができる。

- 5 保護基の脱保護反応は以下の方法によって行なうことができる。

水酸基の保護基としては、例えば、メチル基、トリチル基、メトキシメチル(MOM)基、1-エトキシエチル(EE)基、メトキシエトキシメチル(MEM)基、2-テトラヒドロピラニル(THP)基、トリメチルシリル(TMS)基、トリエチルシリル(TES)基、tert-ブチルジメチルシリル(TBDMS)基、tert-ブチルジフェニルシリル(TBDPS)基、アセチル(Ac)基、ヒバロイル基、ベンゾイル基、ベンジル(Bn)基、p-メトキシベンジル基、アリルオキシカルボニル(Alioc)基、2, 2, 2-トリクロロエトキシカルボニル(Troc)基等が挙げられる。

- 15 アミノ基の保護基としては、例えばベンジルオキシカルボニル基、tert-ブチルオキシカルボニル基、アリルオキシカルボニル(Alioc)基、1-メチル-1-(4-ピコエニル)エトキシカルボニル(Bpoc)基、トリフルオロアセチル基、9-フルオレニルメトキシカルボニル基(Fmoc)、ベンジル(Bn)基、p-メトキシベンジル基、ベンジルオキシメチル(BOM)基、2-(トリメチルシリル)エトキシメチル(SEM)基等が挙げられる。

- 20 チオール基の保護基としては、例えばベンジル基、メトキシベンジル基、メトキシメチル(MOM)基、2-テトラヒドロピラニル(THP)基、ジフェニルメチル基、アセチル(Ac)基が挙げられる。

- 25 水酸基、アミノ基またはチオール基の保護基としては、上記した以外にも容易にかつ選択的に脱離できる基であれば特に限定されない。例えば、T. W. Greene, *Protective Groups in Organic Synthesis*, Wiley, New York, 1999 に記載さ

れたものが用いられる。

水酸基、アミノ基またはチオール基の保護基の脱保護反応はよく知られており、例えば、

- (1) アルカリ加水分解、
- (2) 酸性条件下における脱保護反応、
- (3) 加水素分解による脱保護反応、
- (4) シリル基の脱保護反応、
- (5) 金属を用いた脱保護反応、
- (6) 有機金属を用いた脱保護反応等が挙げられる。

10 これらの方法を具体的に説明すると、

- (1) アルカリ加水分解による脱保護反応は、例えば、有機溶媒（メタノール、テトラヒドロフラン、ジオキサン等）中、アルカリ金属の水酸化物（水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化リチウム等）、アルカリ土類金属の水酸化物（水酸化バリウム、水酸化カルシウム等）または炭酸塩（炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等）あるいはその水溶液もしくはこれらの混合物を用いて、0～40℃の温度で行なわれる。

- (2) 酸条件下での脱保護反応は、例えば、有機溶媒（ジクロロメタン、クロロホルム、ジオキサン、酢酸エチル、アセトニール等）中、有機酸（酢酸、トリフルオロ酢酸、メタンスルホン酸、パーフルオロ酸等）、または無機酸（塩酸、硫酸等）もしくはこれらの混合物（臭化水素/酢酸等）中、0～100℃の温度で行なわれる。

- (3) 加水素分解による脱保護反応は、例えば、溶媒（エーテル系（テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチルエーテル等）、アルコール系（メタノール、エタノール等）、ベンゼン系（ベンゼン、トルエン等）、ケトン系（アセトン、メチルエチルケトン等）、ニトリル系（アセトニトリル等）、アミド系（ジメチルホルムアミド等）、水、酢酸エチル、

酢酸またはそれらの2以上の混合溶媒等）中、触媒（パラジウム-炭素、パラジウム黒、水酸化パラジウム、酸化白金、ラネーニッケル等）の存在下、常圧または加圧下の水素雰囲気下またはギ酸アソモニウム存在下、0～200℃の温度で行なわれる。

- (4) シリル基の脱保護反応は、例えば、水と混和しうる有機溶媒（テトラヒドロフラン、アセトニトリル等）中、テトラアチルアソモニウムフルオリドを用いて、0～40℃の温度で行なわれる。

- (5) 金属を用いた脱保護反応は、例えば、酸性溶媒（酢酸、pH4.2～7.2の緩衝液またはそれらの溶液とテトラヒドロフラン等の有機溶媒との混合物）中、粉末亜鉛の存在下、超音波をかけるかまたは超音波をかけないで、0～40℃の温度で行なわれる。

- (6) 金属結体を用いる脱保護反応は、例えば、有機溶媒（ジクロロメタン、ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン、酢酸エチル、アセトニトリル、ジオキサン、エタノール等）、水またはそれらの混合溶媒中、トランザクト（水素化トリブチルスズ、トリエチルジラン、ジメドリン、モルホリン、ジエチルアミン、ピロリジン等）、有機酸（酢酸、ギ酸、2-エチルヘキサン酸等）および/または有機酸塩（2-エチルヘキサン酸ナトリウム、2-エチルヘキサン酸カリウム等）の存在下、ホスフィン系試薬（トリフェニルホスフィン等）の存在下または非存在下、金属結体（トリフェニルホスフィンパラジウム(0)、二塩化ビス(トリフェニルホスフィン)パラジウム(II)、酢酸パラジウム(II)、塩化トリス(トリフェニルホスフィン)ロジウム(I)等）を用いて、0～40℃の温度で行なわれる。

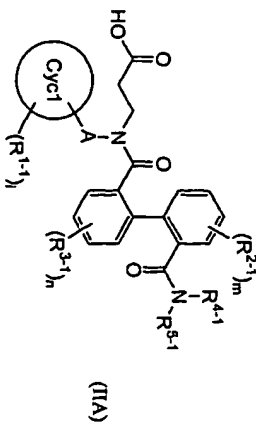
- また、上記以外にも、例えば、T. W. Greene, Protective Groups in Organic Synthesis, Wiley, New York, 1999 に記載された方法によって、脱保護反応を行なうことができる。

当業者には容易に理解できることではあるが、これらの脱保護反応を使い



分けることにより、目的とする本発明化合物が容易に製造することができる。

一般式 (IA) で示される化合物は、一般式 (IIA)



(式中、すべての記号は前記と同じ意味を表わす。) で示される化合物と、

## 5 一般式 (IIB)



(式中、R<sup>42-1</sup>は、R<sup>42</sup>と同じ意味を表わすが、R<sup>42-1</sup>によって表わされる基に含まれる水酸基、またはアミノ基は保護が必要な場合には保護されているものとする。その他の記号は前記と同じ意味を表わす。) で示される化合物をエステル化反応に付し、さらに必要に応じて保護基の脱保護反応に付すことにより製造することができる。

エステル化反応は公知であり、例えば、

- (1) 酸ハライドを用いる方法、
- (2) 混合酸無水物を用いる方法、
- (3) 縮合剤を用いる方法等が挙げられる。

これらの方法を具体的に説明すると、

(1) 酸ハライドを用いる方法は、例えば、カルボン酸を有機溶媒 (クロロホルム、ジクロロメタン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等) 中または無溶媒で、酸ハライド化剤 (オキザリルクロライド、チオニルクロラ

イド等) と -20℃ ~ 還流温度で反応させ、得られた酸ハライドを塩基 (ピリジン、トリエチルアミン、ジメチルアミン、ジメチルアミノピリジン、ジイソプロピルエチルアミン等) の存在下、アルコールと不活性有機溶媒 (クロロホルム、ジクロロメタン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等) 中、0 ~ 40℃ の温度で反応させることにより行なわれる。また、有機溶媒 (ジオキサン、テトラヒドロフラン等) 中、アルカリ水溶液 (重曹水または水酸化ナトリウム溶液等) を用いて、酸ハライドと 0 ~ 40℃ で反応させることにより行なうこともできる。

(2) 混合酸無水物を用いる方法は、例えば、カルボン酸を有機溶媒 (クロロホルム、ジクロロメタン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等) 中または無溶媒で、塩基 (ピリジン、トリエチルアミン、ジメチルアミン、ジメチルアミノピリジン、ジイソプロピルエチルアミン等) の存在下、酸ハライド (ジイソプロピルクロライド、トシルクロライド、メシルクロライド等)、または酸酐導体 (クロロギ酸エチル、クロロギ酸イソブチル等) と、0 ~ 40℃ で反応させ、得られた混合酸無水物を有機溶媒 (クロロホルム、ジクロロメタン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等) 中、アルコールと 0 ~ 40℃ で反応させることにより行なわれる。

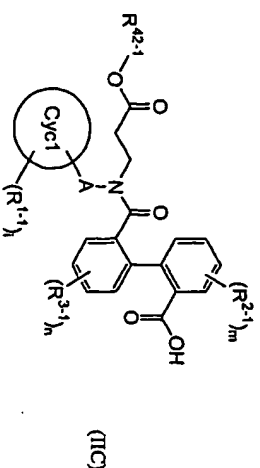
(3) 縮合剤を用いる方法は、例えば、カルボン酸とアルコールを、有機溶媒 (クロロホルム、ジクロロメタン、ジメチルホルムアミド、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等) 中、または無溶媒で、塩基 (ピリジン、トリエチルアミン、ジメチルアミン、ジメチルアミノピリジン等) の存在下または非存在下、縮合剤 (1, 3-ジシクロヘキシルカルボジイミド (DCI)、1-エチル-3-[3-(ジメチルアミノ)プロピル]カルボジイミド (EDCI)、1, 1'-カルボニルジイミダゾール (CDI)、2-クロロ-1-メチルピリジニウムヨウ化物、1-プロピルホスホン酸環状無水物 (1-propanephosphonic acid cyclic anhydride, PPA) 等) を用い、1-ヒドロ

キシペンズトリアゾール (HOBt) を用いるか用いないで、0～40℃で反応させることにより行なわれる。

これら (1)、(2) および (3) の反応は、いずれも不活性ガス (アルゴン、窒素等) 雰囲気下、無水条件で行なうことが望ましい。

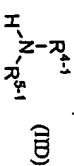
5 水酸基、アミノ基またはチオール基の保護基の脱保護反応は前記と同様の方法により行なうことができる。

一般式 (IA) で示される化合物は、一般式 (IIC)



(式中、すべての記号は前記と同じ意味を表わす。) で示される化合物と、

10 一般式 (IID)



(式中、すべての記号は前記と同じ意味を表わす。) で示される化合物をアミド化反応に付し、さらに必要に応じて保護基の脱保護反応に付すことによっても製造することができる。

15 アミド化反応は公知であり、例えば、

(1) 酸ハライドを用いる方法、

(2) 混合酸無水物を用いる方法、

(3) 縮合剤を用いる方法等が挙げられる。

これらの方法を具体的に説明すると、

(1) 酸ハライドを用いる方法は、例えば、カルボン酸を有機溶媒 (クロロホルム、ジクロロメタン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等) 中または無溶媒で、酸ハライド化剤 (オキサリルクロライド、チオニルクロライド等) と 20℃～還流温度で反応させ、得られた酸ハライドを塩基 (ピリジン、トリエチルアミン、ジメチルアミン、ジメチルアミノピリジン、ジオソプロピルエチルアミン等) の存在下、アミンと不活性有機溶媒 (クロロホルム、ジクロロメタン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等) 中、0～40℃の温度で反応させることにより行なわれる。また、有機溶媒 (ジオキサン、テトラヒドロフラン等) 中、アルカリ水溶液 (重曹水または水酸化ナトリウム溶液等) を用いて、酸ハライドと 0～40℃で反応させることにより行なうこともできる。

(2) 混合酸無水物を用いる方法は、例えば、カルボン酸を有機溶媒 (クロロホルム、ジクロロメタン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等) 中または無溶媒で、塩基 (ピリジン、トリエチルアミン、ジメチルアミン、ジメチルアミノピリジン、ジオソプロピルエチルアミン等) の存在下、酸ハライド (ジバロイルクロライド、トシルクロライド、メシルクロライド等)、または酸誘導体 (クロロギ酸エチル、クロロギ酸イソブチル等) と、0～40℃で反応させ、得られた混合酸無水物を有機溶媒 (クロロホルム、ジクロロメタン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等) 中、アミンと 0～40℃で反応させることにより行なわれる。

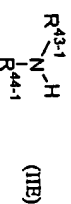
(3) 縮合剤を用いる方法は、例えば、カルボン酸とアミンを、有機溶媒 (クロロホルム、ジクロロメタン、ジメチルホルムアミド、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等) 中、または無溶媒で、塩基 (ピリジン、トリエチルアミン、ジメチルアミン、ジメチルアミノピリジン等) の存在下または非存在下、縮合剤 (1, 3-ジシクロヘキシルカルボジイミド (DCC)、

1-エチル-3-[3-(ジメチルアミノ)プロピル]カルボジイミド (EDC)、1, 1'-カルボニルジイミダゾール (CDI)、2-クロロ-1-メチルピリジニウムヨウ素、1-アロピルホスホン酸環状無水物 (1-propanephosphonic acid cyclic anhydride, PPA) 等を用い、1-ヒドロキシベンズトリアゾール (HOBt) を用いるか用いないで、0~40℃で反応させることにより行なわれる。

これら (1)、(2) および (3) の反応は、いずれも不活性ガス (アルゴン、窒素等) 雰囲気下、無水条件で行なうことが望ましい。

10 水酸基またはアミノ基の保護基の脱保護反応は前記と同様の方法により行なうことができる。

一般式 (IB) で示される化合物は、一般式 (IIA) で示される化合物と、一般式 (IIE) で示される化合物は、



15 (式中、 $R^{43-1}$ および $R^{44-1}$ は、 $R^{43}$ および $R^{44}$ と同じ意味を表わすが、 $R^{43-1}$ および $R^{44-1}$ によって表わされる基に含まれる水酸基、またはアミノ基は保護が必要な場合には保護されているものとする。その他の記号は前記と同じ意味を表わす。) で示される化合物をアミド化反応に付し、さらに必要に応じて保護基の脱保護反応に付すことにより製造することができる。

アミド化反応は前記と同様の方法により行なうことができる。

20 水酸基、アミノ基またはチオール基の保護基の脱保護反応は前記と同様の方法により行なうことができる。

一般式 (IC) で示される化合物は、一般式 (IIA) で示される化合物を還元反応に付し、さらに必要に応じて保護基の脱保護反応に付すことにより製造することができる。

この還元反応は公知であり、例えば、(1) カルボン酸を有機溶媒 (クロロホルム、ジクロロメタン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等) 中または無溶媒で、塩基 (ピリジン、トリエチルアミン、ジメチルアニリン、ジメチルアミノピリジン、ジイソプロピルエチルアミン、N-メチルモルホリン等) の存在下または非存在下、酸ハライド (オキザリルクロライド、チオニルクロライド等)、酸無水物 (無水酢酸等)、または酸誘導体 (クロロギ酸エチル、クロロギ酸イソブチル等) と、-20~60℃で反応させ、得られた化合物を溶媒 (メタノール、テトラヒドロフラン、水等) 中、還元剤 (水酸化ホウ酸ナトリウム、水酸化ホウ酸テトラアチルアンモニウム、水酸化ホウ酸カルシウム等) と0~60℃で反応させることにより行なわれるか、

10 (2) カルボン酸を有機溶媒 (テトラヒドロフラン、トルエン等) 中、還元剤 (ジボラン、ボラン・ピリジン錯体、ボラン・メチルスルフィド錯体、水酸化イソブチルアルミニウム等) と-80~0℃で反応させることにより行なわれる。

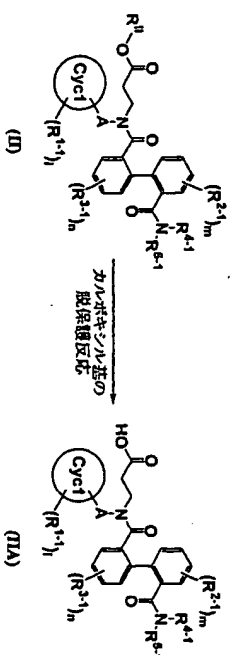
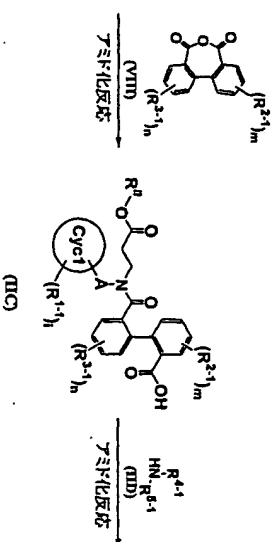
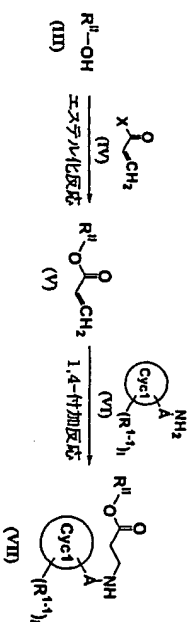
15 水酸基、アミノ基またはチオール基の保護基の脱保護反応は前記と同様の方法により行なうことができる。

一般式 (II) 、(IIA) および (IIC) で示される化合物は、それ自体公知であるか、あるいは公知の方法により容易に製造することができる。

20 一般式 (II) 、(IIA) および (IIC) で示される化合物は、以下の反応工程式1で示される方法により製造することができる。

反応工程式中、Xは脱離基 (脱離基とは、ハロゲン原子、メシルオキシ基、トシルオキシ基等を意味する。) を表わし、その他の記号は前記と同じ意味を表わす。

## 反応工程式 1



反応工程式 1 中、出発原料または中間体として用いる一般式 (III)、(IV)、(V)、(VI)、(VII)、および (IIC) で示される化合物は公知であるか、あるいは公知の方法により容易に製造することができる。

5 本明細書中の各反応において、反応生成物は通常の精製手段、例えば、常圧下または減圧下における蒸留、シリカゲルまたはケイ酸ソレシウムを用いる高速液体クロマトグラフィー、薄層クロマトグラフィー、あるいはカラムクロマトグラフィーまたは洗浄、再結晶等の方法により精製することがで

きる。精製は各反応ごとに行なってもよいし、いくつかの反応終了後に行なってもよい。

## 【毒性】

5 一般式 (I) で示される本発明化合物の毒性は十分に低いものであり、医薬品として使用するために十分安全であることが確認された。

## 産業上の利用可能性

## 【医薬品への適用】

10 一般式 (I) で示される本発明化合物は、LPA 受容体に拮抗することにより、泌尿器系疾患、癌関連疾患、増殖性疾患、炎症・免疫系疾患、分泌障害による疾患または癌関連疾患などの予防および/または治療に有用であると考えられる。

泌尿器系疾患としては、例えば、前立腺肥大症または神経因性膀胱疾患に伴う症状（排尿困難（排尿開始遅延、排尿時間延長、尿線細小、間欠排尿、二段排尿など）、頻尿、夜間頻尿、排尿痛など）、脳血管障害、パーキンソン病、脳腫瘍、多発性硬化症、シヤイートレーガー (Shy-Drager) 症、脊髄腫瘍、椎間板ヘルニア、骨柱管狭窄症、糖尿病などに起因する症状（排尿困難（排尿開始遅延、排尿時間延長、尿線細小、間欠排尿、二段排尿など）、頻尿、夜間頻尿、排尿痛など）、下部尿路症（例えば、下部尿路の開塞疾患など）、下部尿路の炎症性疾患（感染など）、多尿などが考えられる。

25 癌関連疾患としては、例えば、固形腫瘍、固形腫瘍転移、血管線維腫、骨腫瘍、多発性骨腫瘍、カボジ肉腫、白血病などが挙げられる。固形腫瘍の中には、乳癌、肺癌、胃癌、食道癌、結腸直腸癌、肝臓癌、卵巣癌、卵胞膜癌、胎膜、男性胚腫、頸部癌、子宮内腺癌、前立腺癌、腎臓癌、皮膚癌、骨肉腫、脾臓癌、尿路上皮癌、甲状腺癌、脳腫瘍などが挙げられる。また、癌の浸潤転移も LPA 受容体拮抗剤によって抑制されることが考えられる。

増殖性疾患としては、例えば、異常な血管新生を伴う疾患（例えば、胃癌、糖尿病性網膜症、血管新生性緑内障、後水晶体繊維増殖症、甲状腺過形成（バセドウ病を含む）、肺炎症、ネフローゼ症候群、および骨粗しょう症）、動脈閉塞症、肺動脈症などが挙げられる。

5 炎症・免疫性疾患としては、例えば、乾癬、腎症（例えば、IGA腎症など）、その他の炎症・免疫異常による腎炎、肝炎、肺炎症などが挙げられる。分泌障害による疾患としては、例えば、自律神経系異常による分泌障害等が挙げられ、自律神経系異常による分泌障害としては、例えば、シエーグレン（Sjogren）症候群などが挙げられる。

10 脳関連疾患としては、例えば、脳梗塞、脳出血、脳あるいは末梢神経障害などが挙げられる。

一般式（1）で示される本発明化合物、それらのプロドラッグまたはそれらの非毒性塩は、

1 1) その化合物の予防および/または治療効果の補完および/または増強、

15 2) その化合物の動態・吸収改善、投与量の低減、および/または

3) その化合物の副作用の軽減

のために他の薬剤と組み合わせ、併用剤として投与してもよい。

20 一般式（1）で示される本発明化合物と他の薬剤の併用剤は、1つの製剤中に両成分を配合した配合剤の形態で投与してもよく、また別々の製剤にして投与する形態をとってもよい。この別々の製剤にして投与する場合には、同時投与および時間差による投与が含まれる。また、時間差による投与は、一般式（1）で示される本発明化合物を先に投与し、他の薬剤を後に投与してもよいし、他の薬剤を先に投与し、一般式（1）で示される本発明化合物を後に投与してもかまわず、それぞれの投与方法は同じでも異なってもよい。

上記併用剤により、予防および/または治療効果を奏する疾患は特に限定されず、一般式（1）で示される本発明化合物の予防および/または治療効果を補完および/または増強する疾患であればよい。

5 例えば、一般式（1）で示される本発明化合物の泌尿器疾患に対する予防および/または治療効果の補完および/または増強のための他の薬剤としては、他の泌尿器疾患治療剤、例えば、他のLPA受容体拮抗剤、 $\alpha 1$ 遮断剤、抗コリン剤、5 $\alpha$ -リダクターゼ阻害剤、および/または抗アン드로ゲン剤等が挙げられる。ただし、抗コリン剤は前立腺肥大を伴わない場合にのみ用いられる。主として前立腺肥大を伴わない場合の頻尿、尿失禁の治療に用いられる。

10 例えば、一般式（1）で示される本発明化合物の癌疾患領域に対する予防および/または治療効果の補完および/または増強のための他の薬剤としては、例えば、他の癌疾患治療剤等が挙げられる。

15 他のLPA受容体拮抗剤としては、メチル3-（（4-（4-（（1-（2-クロロフェニル）エトキシ）カルボニル）アミノ）-3-メチル-5-イソキサゾリル）ベンジル）スルファニル）プロパノエート等が挙げられる。

20  $\alpha 1$ 遮断剤としては、塩酸テラゾジン、塩酸メナゾジン、ウラビジル、塩酸タムスロジン、メシル酸ドキサゾジン、塩酸アラゾジン、インドラミン、ナフトビジル、塩酸アルフゾジン、AIO-8507L等が挙げられる。

塩酸フロビペリン、臭化フロバンテリン、臭化メチルベンナクサジウム、臭化ナチルスコボラミン、酒石酸トルテロジン、塩化トロスビウム、Z-338、UK-112166-04、KRP-197、ダリフェナジン、YM-905等が挙げられる。

25 5 $\alpha$ -リダクターゼ阻害剤としては、例えば、フィナステリド、G1-998745等が挙げられる。

抗アンδροゲン薬としては、例えば、オキシメクロン、酢酸オサテロン、  
ピカルタミド等が挙げられる。

- 他の癌疾患治療剤としては、例えば、アルキル化剤 (塩酸ナイトロジェン  
マスタード-N-オキシド、シクロホスファミド、イホスファミド、メルフ  
アラシ、チオテパ、カルボコン、フスルファテン等)、ニトロソウレア誘導体  
(塩酸ニムスチン、ラニムスチン等)、代謝拮抗剤 (メトトレキサート、メ  
ルカプトプリン、6-メルカプトプリンボシド、フルオロウラシル、チガフ  
ール、ユーエフテイ、カルモフル、ドキシフルリジン、シタラビン、エノ  
シタビン等)、抗がん性抗生物質 (アクリノマイシンD、マイトマイシンC、  
塩酸ダウノルビシン、塩酸ドキソルビシン、塩酸アクリルビシン、ネオカル  
チノスタチン、ピラルビシン、エビルビシン、イダルビシン、クロモマイシ  
ンA3、フレオマイシン、硫酸ヘプロマイシン等)、植物性アルカロイド (硫  
酸ジノフラナスチン、硫酸ビンクリスチン、硫酸ビンデジシン等)、ホルモン制  
(リン酸エストラムスチンナトリウム、メピチオスタン、エピチオスタノ  
ール、クエン酸タモキシフェン、リン酸ジェチルスチルベストロール、酢酸メ  
ドロキシプロゲステロン等)、免疫強化剤 (レンチナン、ビシパニール、ク  
レスチン、シゾフィラン、ウベニメクス、イソターフェロン等)、その他 (L  
-アスパラギナーゼ、塩酸プロカルバジン、塩酸ミトキサントロン、シスプ  
ラチン、カルボプラチン等) が挙げられる。

- 20 一般式 (1) で示される本発明化合物と他の薬剤の重量比は特に限定され  
ない。

他の薬剤は、任意の2種以上を組み合わせて投与してもよい。

- また、一般式 (1) で示される本発明化合物の予防および/または治療効  
果を補充および/または増強する他の薬剤には、上記したメカニズムに基づ  
いて、現在までに見出されているものだけでなく今後見出されるものも含ま  
れる。

一般式 (1) で示される本発明化合物、または一般式 (1) で示される本  
発明化合物と他の薬剤の併用剤を上記の目的で用いるには、通常、全身的ま  
たは局所的に、経口または非経口の形で投与される。

- 投与量は、年齢、体重、症状、治療効果、投与方法、処理時間等により異  
なるが、通常、成人一人当たり、一回につき、0.01mg から 1000mg、好ま  
しくは 0.1mg から 500mg、さらに好ましくは 0.1mg から 300mg の  
範囲で一日一回から数回経口投与されるか、または成人一人当たり、一回に  
つき、0.01mg から 500mg、好ましくは 0.1mg から 100mg、さらに  
好ましくは 0.1mg から 50mg の範囲で一日一回から数回非経口投与され  
るか、または一日1時間から24時間の範囲で静脈内に持続投与される。

- 10 もちろん前記したように、投与量は種々の条件により変動するので、上記  
投与量より少ない量で十分な場合もあるし、また範囲を超えて投与の必要な  
場合もある。

- 15 一般式 (1) で示される本発明化合物、または一般式 (1) で示される本  
発明化合物と他の薬剤の併用剤を投与する際には、経口投与のための内服  
固形剤、内服注射液および、非経口投与のための注射剤、外用剤、坐剤、点  
眼剤、吸入剤等として用いられる。

- 20 経口投与のための内服固形剤には、錠剤、丸剤、カプセル剤、散剤、顆  
粒剤等が含まれる。カプセル剤には、ハードカプセルおよびソフトカプセル  
が含まれる。

- 25 このような内服固形剤においては、ひとつまたはそれ以上の活性物質は  
そのままか、または賦形剤 (ラクトース、マンニトール、グルコース、微結  
晶セルロース、デンプン等)、結合剤 (ヒドロキシプロピルセルロース、ポ  
リビニルピロリドン、メタケイ酸アルミン酸マグネシウム等)、崩壊剤 (纖  
維素グリコール酸カルシウム等)、滑沢剤 (ステアリン酸マグネシウム等)、  
安定剤、溶解補助剤 (タルタミン酸、アスパラギン酸等) 等と混合され、常

法に従って製剤化して用いられる。また、必要によりコーティング剤（白糖、ゼラチン、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロースフタレート等）で被覆していてもよいし、また2以上の層で被覆していてもよい。さらにゼラチンのような吸収されうる物質のカプセルも含まれる。

5 経口投与のための内服用液剤は、果剂的に許容される水和、懸濁剤、乳剤、シロップ剤、エリキシル剤等を含む。このような液剤においては、ひとつまたはそれ以上の活性物質が、一般的に用いられる希釈剤（精製水、エタノールまたはそれらの混液等）に溶解、懸濁または乳化される。さらにこの液剤は、温潤剤、懸濁化剤、乳化剤、甘味剤、風味剤、芳香剤、保存剤、緩衝剤等を含んでいる。

10 非経口投与のための外用剤の剤形には、例えば、軟膏剤、ゲル剤、クリーム剤、湿布剤、貼付剤、リニメント剤、噴霧剤、吸入剤、スプレー剤、エアゾル剤、点眼剤、および点鼻剤等が含まれる。これらはひとつまたはそれ以上の活性物質を含み、公知の方法または通常使用されている処方により調製される。

軟膏剤は公知または通常使用されている処方により製造される。例えば、ひとつまたはそれ以上の活性物質を基剤に研和、または溶解させて調製される。軟膏基剤は公知あるいは通常使用されているものから選ばれる。

20 例えば、  
高級脂肪酸または高級脂肪酸エステル（アジピン酸、ミリスチン酸、パルミチン酸、ステアリン酸、オレイン酸、アジピン酸エステル、ミリスチン酸エステル、パルミチン酸エステル、ステアリン酸エステル、オレイン酸エステル等）、ロウ類（ミツロウ、蜂ロウ、セリン等）、界面活性剤（ポリオキシエチレンアルキルエーテルリン酸エステル等）、高級アルコール（セタノール、ステアリアルアルコール、セトステアリアルアルコール等）、シリコン

油（ジメチルポリシロキサン等）、炭化水素類（親水ワセリン、白色ワセリン、精製ラノリン、流動パラフィン等）、グリコール類（エチレングリコール、ジエチレングリコール、プロピレングリコール、ポリエチレングリコール、ワクロゴール等）、植物油（ヒマシ油、オリーブ油、ごま油、テレピン油等）、動物油（ミンク油、卵黄油、スクワラン、スクвален等）、水、吸収促進剤、かぶれ防止剤から選ばれるもの単独または2種以上を混合して用いられる。さらに、保湿度剤、保存剤、安定化剤、抗酸化剤、着色剤等を含んでいる。

5 ゲル剤は公知または通常使用されている処方により製造される。例えば、ひとつまたはそれ以上の活性物質を基剤に溶解させて調製される。ゲル基剤は公知あるいは通常使用されているものから選ばれる。例えば、低級アルコール（エタノール、イソプロピルアルコール等）、ゲル化剤（カルボキシメチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、エチルセルロース等）、中和剤（トリエタノールアミン、ジイソプロパノールアミン等）、界面活性剤（モノステアリン酸ポリエチレングリコール等）、ガム類、水、吸収促進剤、かぶれ防止剤から選ばれるもの単独または2種以上を混合して用いられる。さらに、保存剤、抗酸化剤、着色剤等を含んでいる。

15 クリーム剤は公知または通常使用されている処方により製造される。例えば、ひとつまたはそれ以上の活性物質を基剤に溶解または乳化させて調製される。クリーム基剤は公知あるいは通常使用されているものから選ばれる。

20 例えば、高級脂肪酸エステル、低級アルコール、炭化水素類、多価アルコール（プロピレングリコール、1, 3-ブチレングリコール等）、高級アルコール（2-ヘキシルデカノール、セタノール等）、乳化剤（ポリオキシエチレンアルキルエーテル類、脂肪酸エステル類等）、水、吸収促進剤、かぶれ防止剤から選ばれるもの単独または2種以上を混合して用いられる。さらに、

保存剤、抗酸化剤、増香剤等を含んでもよい。

- 5 湿布剤は公知または通常使用されている処方により製造される。例えば、ひとつまたはそれ以上の活性物質を基剤に溶解させ、練合物とし支持体上に展延塗布して製造される。湿布基剤は公知あるいは通常使用されているものから選ばれる。例えば、増粘剤（ポリアクリル酸、ポリビニルピロリドン、アラビアゴム、デンプン、メチルセルロース等）、湿潤剤（尿素、グリセリン、プロピレングリコール等）、充填剤（カオリン、酸化亜鉛、タルク、カルシウム、マгнеシウム等）、水、溶解補助剤、粘着付与剤、かぶれ防止剤から選ばれるもの単独または2種以上を混合して用いられる。さらに、保存剤、抗酸化剤、増香剤等を含んでもよい。

- 10 貼付剤は公知または通常使用されている処方により製造される。例えば、ひとつまたはそれ以上の活性物質を基剤に溶解させ、支持体上に展延塗布して製造される。貼付利用基剤は公知あるいは通常使用されているものから選ばれる。例えば、高分子基剤、油脂、高級脂肪酸、粘着付与剤、かぶれ防止剤から選ばれるもの単独または2種以上を混合して用いられる。さらに、保存剤、抗酸化剤、増香剤等を含んでもよい。

- 15 リニメント剤は公知または通常使用されている処方により製造される。例えば、ひとつまたはそれ以上の活性物質を水、アルコール（エタノール、ポリエチレングリコール等）、高級脂肪酸、グリセリン、セツケン、乳化剤、懸濁化剤等から選ばれるもの単独または2種以上に溶解、懸濁または乳化させて調製される。さらに、保存剤、抗酸化剤、増香剤等を含んでもよい。
- 20 噴霧剤、吸入剤、およびスプレー剤は、一般的に用いられる希釈剤以外に亜硫酸水素ナトリウムのような安定剤と等張性を与えるような緩衝剤、例えば塩化ナトリウム、クエン酸ナトリウムあるいはクエン酸のような等張剤を含有していてもよい。スプレー剤の製造方法は、例えば米国特許第2,868,691号および同第3,095,355号に詳しく記載されている。

- 5 非経口投与のための注射剤としては、溶液、懸濁液、乳濁液および用時溶剤に溶解または懸濁して用いる固形の注射剤を包含する。注射剤は、ひとつまたはそれ以上の活性物質を溶剤に溶解、懸濁または乳化させて用いられる。溶剤として、例えば注射用蒸留水、生理食塩水、植物油、プロピレングリコール、ポリエチレングリコール、エタノールのようなアルコール類等およびそれらの組み合わせが用いられる。さらにこの注射剤は、安定剤、溶解補助剤（グルタミン酸、アスパラギン酸、ポリソルベート80（登録商標）等）、懸濁化剤、乳化剤、無痛化剤、緩衝剤、保存剤等を含んでもよい。これらは最終工程において滅菌するか無菌操作法によって製造される。また無菌の固形剤、例えば凍結乾燥品を製造し、その使用前に無菌化または無菌の注射用蒸留水または他の溶剤に溶解して使用することもできる。

非経口投与のための点眼剤には、点眼液、懸濁型点眼液、乳濁型点眼液、用時溶解型点眼液および眼軟膏が含まれる。

- 10 これらの点眼剤は公知の方法に準じて製造される。例えば、ひとつまたはそれ以上の活性物質を溶剤に溶解、懸濁または乳化させて用いられる。点眼剤の溶剤としては、例えば、滅菌精製水、生理食塩水、その他の水性溶剤または注射用非水性用剤（例えば、植物油等）等およびそれらの組み合わせが用いられる。点眼剤は、等張化剤（塩化ナトリウム、濃グリセリン等）、緩衝化剤（リン酸ナトリウム、酢酸ナトリウム等）、界面活性化剤（ポリソルベート80（商品名）、ステアリン酸ポリオキシシル40、ポリオキシエチレン硬化ヒポソ油等）、安定化剤（クエン酸ナトリウム、エデト酸ナトリウム等）、防腐剤（塩化ベンザルコニウム、パラベン等）などが必要に応じて適宜選択して含んでもよい。これらは最終工程において滅菌するか、無菌操作法によって製造される。また無菌の固形剤、例えば凍結乾燥品を製造し、その使用前に無菌化または無菌の滅菌精製水または他の溶剤に溶解して使用することもできる。



非経口投与のための吸入剤としては、エアロゾル剤、吸入用粉末剤又は吸入用液剤が含まれ、当該吸入用液剤は用時に水又は他の適当な媒体に溶解又は懸濁させて使用する形態であってもよい。

これらの吸入剤は公知の方法に準じて製造される。

5 例えば、吸入用液剤の場合には、防腐剤（塩化ベンザルコニウム、パラベン等）、着色剤、緩衝化剤（リン酸ナトリウム、酢酸ナトリウム等）、等張化剤（塩化ナトリウム、濃グリセリン等）、増粘剤（カリボキシビニルポリマー等）、吸収促進剤などを必要に応じて適宜選択して調製される。

吸入用粉末剤の場合には、消沫剤（ステアリン酸およびその塩等）、結合剤（デンプン、デキストリン等）、賦形剤（乳糖、セルロース等）、着色剤、防腐剤（塩化ベンザルコニウム、パラベン等）、吸収促進剤などを必要に応じて適宜選択して調製される。

10 吸入用液剤を投与する際には通常噴霧器（アトマイザー、ネブライザー）が使用され、吸入用粉末剤を投与する際には通常粉末薬剤用吸入投与器が使用される。

15 非経口投与のためその他の組成物としては、ひとつまたはそれ以上の活性物質を含み、常法により処方される舌下投与のための舌下剤、直腸内投与のための坐剤および膈内投与のためのベッサリー等が含まれる。

20 一般式（I）で示される本発明化合物の局所投与としては、疾患の部位へ薬剤を局所的に供給できればよく、その投与方法に限定されない。例えば、筋肉内、皮下、臓器、関節部位などへの注射剤、埋め込み剤、顆粒剤、散剤等の固形製剤、軟膏剤等が挙げられる。

一般式（I）で示される本発明化合物の持続性製剤としてはとして、疾患の部位で、薬剤を持続的に供給できればよく、その製剤に限定されない。

25 例えば、徐放性注射剤（例えば、ワイクロカサセル製剤、ワイクロスフェア製剤、ナノスフェア製剤等）、埋め込み製剤（例えば、フイルム製剤等）等

が挙げられる。

上記したワイクロカサセル製剤、ワイクロスフェア製剤、ナノスフェア製剤とは、活性成分として一般式（I）で示される本発明化合物、または一般式（I）で示される本発明化合物と他の薬剤の併用剤を含有し、生体内分解性重合物との微粒子状の医薬組成物である。

5 本発明の生体内分解性重合物とは、脂肪酸エステル重合体またはその共重合体、ポリアクリル酸エステル類、ポリヒドロキシ酪酸類、ポリアルキレンオキシレート類、ポリオルソエステル、ポリカーボネートおよびポリアミノ酸類が挙げられ、これらは1種類またはそれ以上混合して使用することができる。脂肪酸エステル重合体またはその共重合体とは、ポリ乳酸、ポリグリコール酸、ポリクエン酸、ポリリノコ酸および乳酸-グリコール酸共重合体

10 が挙げられ、これらは1種類またはそれ以上混合して使用することができる。その他に、ポリ $\alpha$ -シアノアクリル酸エステル、ポリ $\beta$ -ヒドロキシ酪酸、ポリトリメチレンオキシレート、ポリオルソエステル、ポリオルソカーボネート、ポリエチレンカーボネート、ポリ $\gamma$ -ベンジルーグルタミン酸およびポリ $\gamma$ -アラニンの1種類またはそれ以上混合も使用することができる。

15 好ましくは、ポリ乳酸、ポリグルコール酸または乳酸-グリコール酸共重合体であり、より好ましくは、乳酸-グリコール酸共重合体である。

20 本発明に使用されるこれらの生体内分解性高分子重合物の平均分子量は約2,000 ないし約800,000 のものが好ましく、より好ましくは約5,000 ないし約200,000 である。例えば、ポリ乳酸において、その重量平均分子量は約5,000 から約100,000 のものが好ましい。さらに好ましくは約6,000 から約50,000 である。ポリ乳酸は、自体公知の製造方法に従って合成できる。乳酸-グリコール酸共重合物においては、その乳酸とグリコール酸との組成比は約10

25 0/0 から約50/50 (W/W) が好ましく、特に約90/10 から50/50 (W/W) が好ましい。乳酸-グリコール酸共重合物の重量平均分子量は

約 5,000 から約 100,000 が好ましい。さらに好ましくは約 10,000 から 80,000 である。乳酸-グリコール酸共重合物は、自体公知の製造方法に従って合成できる。

5 本明細書中、重量平均分子量は、ゲルパーミエーションクロマトグラフィー (GPC) で測定したポリスチレン換算の分子量をいう。

前記した生体内分解性高分子重合物は、本発明の目的が達成される限り、一般式 (1) で示される本発明化合物の薬理活性の強さと、目的とする薬物放出によって変えることができる。例えば当該生理活性物質に対して約 0.2 ないし 10,000 倍 (重量比) の量で用いられ、好ましくは約 1 ないし 1,000 倍 (重量比)、さらに好ましくは約 1 ないし 100 倍 (重量比) の量で用いるのがよい。

発明を実施するための最良の形態

以下、参考例および実施例によって本発明を詳述するが、本発明はこれらに限定されるものではない。

クロマトグラフィーによる分離の箇所、TLC に示されているカッコ内の溶媒は、使用した溶出溶媒または展開溶媒を示し、割合は体積比を表わす。

NMR の箇所を示されているカッコ内の溶媒は、測定に使用した溶媒を示している。

20

#### 参考例 1

3- (2- (4-エトキシフェニル) エチル) アミノプロパノ酸 エチルエステル 塩酸塩

25 4-エトキシフェニルアミン (2.2 g) とアクリル酸エチル (1.5 g) をエタノール (25 ml) に溶解し、室温にて 3 日間撹拌した。減圧下エタノールを除去し、得られた残渣に 4N 塩化水素 酢酸エチル溶液を加えた。減圧

下溶媒を除去し、得られた残渣をジイソプロピルエーテルにて洗浄して、以下の物性値を有する環状化合物 (4.0 g) を得た。

TLC : Rf 0.89 (クロロホルム : メタノール = 9 : 1) ;

5 NMR(DMSO-d<sub>6</sub>) : δ 9.10 (brs, 2H), 7.16 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.87 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.11 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 3.99 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 3.40-3.00 (m, 4H), 3.00-2.85 (m, 2H), 2.79 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 1.31 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.21 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

#### 参考例 2

3- (N- ( (2- (2-カルボキシフェニル) フェニル) カルボニル) -  
10 N- (2- (4-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸 エチルエステル

参考例 1 で製造した化合物 (6.00 mg)、ジフェン酸無水物 (5.38 mg) およびトリエチルアミン (0.85 ml) を塩化メチレン (10 ml) に溶解し、室温にて一晩撹拌した。反応混合物を酢酸エチルと 1N 塩酸の混合液に加え、水層を酢酸エチルにて抽出した。有機層を合わせ、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液および飽和食塩水にて洗浄し、無水硫酸ナトリウムにて乾燥した。溶媒を除去して、以下の物性値を有する環状化合物 (8.37 mg) を得た。

TLC : Rf 0.50 (クロロホルム : メタノール = 9 : 1) ;

20 NMR(DMSO-d<sub>6</sub>) : δ 7.90-7.15 (m, 8H), 7.00-6.70 (m, 4H), 4.00-3.90 (m, 4H), 3.80-3.00 (m, 4H), 2.60-2.00 (m, 4H), 1.35-1.05 (m, 6H)。

#### 実施例 1

3- (N- ( (2- (2- (ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸 エチルエステル

参考例 2 で製造した化合物 (150 mg)、3-ピコリルアミン (50 mg) および 1-エチル-3- [3- (ジメチルアミノ) プロピル] カルボジイミド塩酸塩 (180 mg) を塩化メチレン (5 ml) に溶解し、室温にて一晩撹拌した。反応混合物を酢酸エチルと 1 N 塩酸の混合溶媒に加え、水層を酢酸エチルにて抽出した。有機層を合わせ、飽和食塩水にて洗浄した後無水硫酸ナトリウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム: 酢酸エチル = 1 : 2) にて精製して、以下の物性値を有する本発明化合物 (147 mg) を得た。

TLC : Rf 0.20 (クロロホルム: 酢酸エチル = 3 : 2) ;

10 NMR(DMSO-d<sub>6</sub>) : δ 9.00-8.10 (m, 2H), 7.60-6.75 (m, 17H), 4.40-3.90 (m, 4H), 3.80-3.10 (m, 4H), 2.80-2.05 (m, 4H), 1.40-1.30 (m, 3H), 1.20-1.10 (m, 3H)。

#### 実施例 1 (1) ~ (4)

4-エトキシフェニルアミンの代わりに相当するアミンを用いて、参考例 1 → 参考例 2 で示される方法と同様に操作し、さらに相当するアミンを用いて、実施例 1 で示される方法と同様に操作して、以下に示す本発明化合物を得た。

#### 実施例 1 (1)

20 3- (N- ( (2- (2- (ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸 エチルエステル  
TLC : Rf 0.14 (クロロホルム: 酢酸エチル = 1 : 1) 。

#### 実施例 1 (2)

3- (N- ( (2- (2- (ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル

ル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸 エチルエステル

TLC : Rf 0.91 (塩化メチレン: メタノール = 9 : 1) ;

5 NMR(DMSO-d<sub>6</sub>) : δ 9.10-8.60 (m, 1H), 7.60-6.70 (m, 17H), 4.40-3.80 (m, 6H), 3.80-3.00 (m, 4H), 2.80-2.00 (m, 4H), 1.40-1.20 (m, 3H), 1.20-1.10 (m, 3H)。

#### 実施例 1 (3)

3- (N- ( (2- (2- (メチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸 エチルエステル

10 TLC : Rf 0.62 (塩化メチレン: 酢酸エチル = 2 : 1) ;

MASS (APCI, Pos., 40V) : 503 (M + H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 1 (4)

15 3- (N- ( (2- (2- (ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- フェニルエチルアミノ) ) プロパノ酸 エチルエステル  
TLC : Rf 0.73 (塩化メチレン: 酢酸エチル = 4 : 1) ;

MASS (APCI, Pos., 40V) : 535 (M + H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 2

20 3- (N- ( (2- (2- (ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

25 実施例 1 で製造した化合物 (110 mg) と 1 N 水酸化ナトリウム水溶液 (0.5 ml) をエタノール (1 ml) とテトラヒドロフラン (2 ml) の混合

溶媒に溶解し、室温にて2時間攪拌した。反応混合物を酢酸エチルと1N塩酸の混合溶媒に加え、水層を酢酸エチルにて抽出した。有機層を合わせ、飽和食塩水にて洗浄した後無水硫酸ナトリウムにて乾燥した。溶媒を留去して、以下の物性値を有する本発明化合物 (77 mg) を得た。

5 T L C : R f 0.36 (クロロホルム : メタノール = 9 : 1) ;

NMR(DMSO-d<sub>6</sub>) : δ 9.00-8.30 (m, 2H), 7.60-6.70 (m, 15H), 4.60-4.10 (m, 2H), 4.00-3.90 (m, 2H), 3.90-3.00 (m, 4H), 2.80-2.65 (m, 2H), 2.20-2.00 (m, 2H), 1.40-1.20 (m, 3H)。

#### 10 実施例 2 (1) ~ (4)

実施例 1 で製造した化合物の代わりに実施例 1 (1) ~ (4) で製造した化合物を用いて、実施例 2 で示される方法と同様に操作して、以下に示す本発明化合物を得た。

#### 15 実施例 2 (1)

3 - (N - ( (2 - (2 - (ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N - (2 - (4-メトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

T L C : R f 0.56 (クロロホルム : メタノール = 9 : 1) ;

20 NMR(DMSO-d<sub>6</sub>, 100°C) : δ 8.55 (brs, 1H), 8.48 (dd, J = 1.2, 4.8 Hz, 1H), 8.30 (s, 1H), 7.60-6.95 (m, 12H), 6.81 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 4.30-4.20 (m, 2H), 3.73 (s, 3H), 3.50 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 3.42 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 2.80-2.60 (m, 2H), 2.20-2.10 (m, 2H)。

#### 25 実施例 2 (2)

3 - (N - ( (2 - (2 - (ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル

ル) カルボニル) -N - (2 - (4-エトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

T L C : R f 0.67 (クロロホルム : メタノール = 9 : 1) ;

5 NMR(DMSO-d<sub>6</sub>) : δ 9.10-8.60 (m, 1H), 7.60-6.70 (m, 17H), 4.40-3.80 (m, 4H), 3.80-3.00 (m, 4H), 2.80-1.90 (m, 4H), 1.40-1.20 (m, 3H)。

#### 10 実施例 2 (3)

3 - (N - ( (2 - (2 - (メチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N - (2 - (4-エトキシフエニル) エチル) アミノ) フロ

バベン酸

T L C : R f 0.53 (クロロホルム : メタノール = 9 : 1) ;

NMR(DMSO-d<sub>6</sub>) : δ 8.50-8.00 (m, 1H), 7.60-6.70 (m, 12H), 4.00-3.90 (m, 2H), 3.80-3.00 (m, 4H), 2.80-2.00 (m, 7H), 1.40-1.30 (m, 3H)。

#### 15 実施例 2 (4)

3 - (N - ( (2 - (2 - (ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N - (2 - フエニルエチル) アミノ) フロバベン酸

T L C : R f 0.47 (クロロホルム : メタノール = 9 : 1) ;

M A S S (APCI, Neg, 40V) : 505 (M-H)<sup>-</sup>。

20

#### 参考例 3

固相担持アクリル酸エステル

アクリル酸モノメチルアミン塩 Wang 樹脂 (アクリルモノト社製、カタログ番号 800296) (1.06 mmol / g, 10.0 g) の塩化メチレン (100 ml

25 1) 懸濁液に、N, N-ジイソプロピルエチルアミン (9.17 ml) とアクリル酸クロリド (2.58 ml) を -78°C にて加え、室温にて 16 時間攪拌した。反

応混合物から樹脂を濾取し、塩化メチレン (150 ml × 4) および N-メチル-2-ピロリドン (100 ml × 3) にて洗浄して、固相担持アクリル酸エステルを得た。

#### 5 参考例 4

固相担持 3- (2- (2, 5-ジメトキシフエニル) エチル) アミノプロパン酸エステル

参考例 3 で製造した化合物の N-メチル-2-ピロリドン (100 ml) 溶液に 2, 5-ジメトキシフエチルアミン (9.60 g) を加え、室温にて 26 時間攪拌した。反応混合物から樹脂を濾取し、N-メチル-2-ピロリドン (100 ml × 3) および塩化メチレン (100 ml × 4) にて洗浄した。得られた樹脂を減圧下乾燥して、固相担持 3- (2- (2, 5-ジメトキシフエニル) エチル) アミノプロパン酸エステルを得た (13.70 g)。

#### 15 参考例 5

固相担持 3- (N- ( (2- (2-カルボキシフエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 5-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパン酸エステル

参考例 4 で製造した化合物 (4.00 g) の N-メチル-2-ピロリドン (40 ml) 懸濁液にジフエノ酸無水物 (6.93 g) を加え、室温にて 16 時間攪拌した。反応混合物から樹脂を濾取し、N, N-ジメチルホルムアミド (50 ml × 5) にて洗浄して、固相担持 3- (N- ( (2- (2-カルボキシフエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 5-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパン酸エステルを得た。

#### 25 参考例 6

固相担持 3- (N- ( (2- (2- (4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 5-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパン酸エステル

参考例 5 で製造した化合物の N, N-ジメチルホルムアミド (40 ml) 溶液に、4-クロロベンジルアミン (3.76 ml)、1-ヒドロキシベンズトリアゾール-水合物 (4.73 g) および N, N-ジイソプロピルカルボジイミド (4.84 ml) を加え、室温にて 16 時間攪拌した。反応混合物から樹脂を濾取し、N, N-ジメチルホルムアミド (50 ml × 3)、塩化メチレン (50 ml × 3)、メタノール (50 ml × 2) および塩化メチレン (50 ml × 2) にて順次洗浄して、固相担持 3- (N- ( (2- (2- (4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 5-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパン酸エステルを得た。

#### 15 実施例 3

3- (N- ( (2- (2- (4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 5-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパン酸

参考例 6 で製造した化合物をトリフルオロ酢酸と水の混合溶媒 (9 : 1, 40 ml) に懸濁し、室温にて 1 時間攪拌した。反応混合物を濾過し、樹脂をトリフルオロ酢酸と水の混合溶媒 (9 : 1, 40 ml) にて洗浄した。濾液を合わせ、減圧下濃縮して得られた残液をトルエン (20 ml) にて 2 回共沸した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル : メタノール : 酢酸 = 100 : 1 : 0.1) にて精製して、以下の物性値を有する本発明化合物 (1.106 g) を得た。

25 する本発明化合物 (1.106 g) を得た。  
TLC : Rf 0.27 (酢酸エチル : メタノール : 酢酸 = 100 : 1 : 0.1) ;

<sup>1</sup>H NMR (DMSO-d<sub>6</sub>) : δ 12.22 (s, 1H), 9.00-8.60 (m, 1H), 7.60-7.30 (m, 5H), 7.30-7.00 (m, 4H), 6.97 (m, 1H), 6.90-6.40 (m, 5H), 4.45-4.25 (m, 1H), 4.23-3.90 (m, 1H), 3.80-3.10 (m, 1H), 2.78 (m, 1H), 2.49 (m, 1H), 2.08 (m, 1H)。

### 5 実施例 3 (1)

3- (N- ( (2- (2- (ピリジン-3-イルメチルアミン) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 5-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

4-クロロベンジルアミンの代わりに 3-ピリジルメチルアミンを用いて、参考例 6 → 実施例 3 で示される方法と同様に操作し、さらに必要により公知の方法によって相当する塩に変換して、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

フリー体:

TLC : R<sub>f</sub> 0.57 (クロロホルム : メタノール : 酢酸 = 9 : 1 : 0.5) :

<sup>1</sup>H NMR (CD<sub>3</sub>OD) : δ 8.61 (m, 1H), 8.34 (br, 1H), 7.73 (m, 2H), 7.64-7.54 (m, 1H), 7.54-7.38 (m, 2H), 7.38-7.20 (m, 2H), 7.16-7.02 (m, 2H), 6.86-6.74 (m, 2H), 6.74-6.60 (m, 2H), 4.58 (d, J = 15.3 Hz, 1H), 4.18 (d, J = 15.3 Hz, 1H), 3.90-3.70 (m, 1H), 3.72 (s, 3H), 3.53 (s, 3H), 3.65-3.35 (m, 2H), 2.88 (m, 2H), 2.80-2.40 (br, 1H), 2.22 (t, J = 7.2 Hz, 2H)。

### 20 塩酸塩:

TLC : R<sub>f</sub> 0.18 (酢酸エチル : メタノール : 酢酸 = 9 : 0 : 9 : 0.2) ;  
<sup>1</sup>H NMR (DMSO-d<sub>6</sub>) : δ 9.20-8.90 (m, 1H), 8.79 (m, 1H), 8.70-8.30 (m, 1H), 8.10-7.70 (m, 2H), 7.60-6.60 (m, 1H), 4.70-4.45 (m, 1H), 4.35-4.10 (m, 1H), 3.80-3.10 (m, 1H), 2.85-2.60 (m, 1H), 2.55-2.30 (m, 1H), 2.25-1.95 (m, 1H)。

25

### 参考例 7

固相担持アクリル酸エステル

アルゴン雰囲気下、Lantern PS-Wang (登録商標) (ミモトアズマ社製、コード番号 SPSLHMP) (16.0 μmol / ランタン、1000 本) を塩化メチレン (198 ml) に加え、N, N-ジイソプロピルエチルアミン (77.9 ml) とアクリル酸クロリド (24.4 ml) を -78℃ にて加えた。反応混合物を室温にて 15 時間撹拌した。反応混合物から固相担体を濾取し、塩化メチレン (150 ml × 5) にて洗浄後風乾して、固相担持アクリル酸エステルを得た。

### 参考例 8

10 固相担持 3-ベンジルアミノプロパノ酸エステル

参考例 7 で製造した化合物 (4.5 本, 0.72 mmol) をベンジルアミンの N-メチル-2-ピロリドン溶液 (1.0 M, 1.5 ml) 溶液に加えて、室温にて 16 時間撹拌した。反応混合物から固相担体を濾取し、N-メチル-2-ピロリドン (20 ml × 4) にて洗浄して、固相担持 3-ベンジルアミノプロパノ酸エステルを得た。

### 参考例 9

固相担持 3- (N- ( (2- (2-カルボキシフェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロパノ酸エステル

20 参考例 8 で製造した化合物 (1350 本, 21.6 mmol) を N-メチル-2-ピロリドン (500 ml) に加え、ジフェニル酸無水物 (48.4 g) を加えた。反応混合物を 50℃ にて 60 時間撹拌した。反応混合物から固相担体を濾取し、N, N-ジメチルホルムアミン (500 ml × 4) および塩化メチレン (500 ml × 3) にて洗浄した。得られた固相担体を風乾して、固相担持 3- (N- ( (2- (2-カルボキシフェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロパノ酸エステルを得た。

25

参考例 10

固相担持 3- (N- ( (2- (2- (3-メチルベンジルアミノ) カルボ  
ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロ  
5 パン酸エステル

参考例 9 で製造した化合物 (30本、0.48mmol) を N, N-ジメチルホル  
ムアミン (10ml) に加え、3-メチルベンジルアミン (2.40mmol)、  
1-ヒドロキシベンズトリアゾール-水合物 (368mg) および N, N-  
ジイソプロピルカルボジイミド (0.376ml) を加えた。反応混合物を室温に  
10 て 16 時間攪拌した。反応混合物から固相担体を濾取し、N, N-ジメチル  
ホルムアミン (10ml × 3) および塩化メチレン (10ml × 3) にて洗  
淨した。得られた固相担体を風乾して、固相担持 3- (N- ( (2- (2-  
(3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボ  
ニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロパン酸エステルを得た。

15

実施例 4

3- (N- ( (2- (2- (3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェ  
ニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロパン酸  
参考例 10 で製造した化合物 (1本、0.016mmol) をトリフルオロ酢酸  
20 (0.5ml) に加え、室温にて 1 時間処理した。固相担体を取り出し、トリフ  
ルオロ酢酸 (0.5ml) で洗浄した。洗浄液を合わせ、減圧下濃縮して、以下  
の物性値を有する本発明化合物を得た。高速液体クロマトグラフィー (HPLC) を用いた分析条件を以下に示す。

25 使用したカラム: Xterra (登録商標) MS C<sub>18</sub>, 4.6 × 50mm I.D., 5µm, 100Å  
使用した流速: 3 mL/min  
使用した溶媒

A 液: 0.1% トリフルオロ酢酸水溶液

B 液: 0.1% トリフルオロ酢酸-アセトニトリル溶液

測定開始後 0.5 分間は A 液と B 液の混合比を 95/5 に固定した。その後  
2.5 分間で A 液と B 液の混合比を 0/100 に直線的に変えた。その後 0.5 分  
5 間 A 液と B 液の混合比を 0/100 に固定した。その後 0.01 分間で A 液と B  
液の混合比を 95/5 に直線的に変えた。

HPLC 保持時間: 3.84 分;

MASS データ (ESI, Pos, 20V): 507 (M+H)<sup>+</sup>。

10 実施例 4 (1) ~ (1.15.4)

ベンジルアミンの代わりに相当するアミンを用いて、参考例 8 → 参考例 9  
で示される方法と同様に操作し、さらに 3-メチルベンジルアミンの代わり  
に相当するアミンを用いて、参考例 10 → 実施例 4 で示される方法と同様に  
操作して、以下の本発明化合物を得た。

15

高速液体クロマトグラフィー (HPLC) を用いた分析条件を以下に示す。

HPLC 条件 A

使用したカラム: Xterra (登録商標) MS C<sub>18</sub>, 4.6 × 50mm I.D., 5µm, 100Å

使用した流速: 3 mL/min

使用した溶媒

20 A 液: 0.1% トリフルオロ酢酸水溶液

B 液: 0.1% トリフルオロ酢酸-アセトニトリル溶液

測定開始後 0.5 分間は A 液と B 液の混合比を 95/5 に固定した。その後  
2.5 分間で A 液と B 液の混合比を 0/100 に直線的に変えた。その後 0.5 分  
間 A 液と B 液の混合比を 0/100 に固定した。その後 0.01 分間で A 液と B  
25 液の混合比を 95/5 に直線的に変えた。

HPLC 条件 B

使用したカラム: Phenomenex Max-RP, 2×50mm ID, 4μm, 80Å

使用した流速: 250 μL/min

使用した溶媒

A液: 0.05% 酢酸水溶液

5 B液: 0.05% 酢酸-アセトニトリル溶液

測定開始時A液とB液の混合比を95/5にした。その後3.5分間でA液とB液の混合比を20/80に直線的に変えた。その後0.5分間でA液とB液の混合比を10/90に直線的に変えた。その後0.8分間A液とB液の混合比を10/90に固定した。その後1分間でA液とB液の混合比を95/5に直線的に変えた。

10

#### 実施例 4 (1)

3-(N-(2-(2-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(1

15 H-インドル-3-イル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.89分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V): 586 (M+H)<sup>+</sup>。

20 実施例 4 (2)

3-(N-(2-(2-(2-トリルメチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(1H-インドル-3-イル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件: A

25 HPLC保持時間: 3.64分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V): 536 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (3)

3-(N-(2-(2-(1-インダンアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(1H-インドル-3-イル)エチル)アミノ)プロパン酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.82分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V): 572 (M+H)<sup>+</sup>。

10 実施例 4 (4)

3-(N-(2-(2-(1-ナフチルメチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(1H-インドル-3-イル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件: A

15 HPLC保持時間: 3.89分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V): 596 (M+H)<sup>+</sup>, 214。

#### 実施例 4 (5)

3-(N-(2-(2-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-β-カルボリソ-2-イル)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(1H-インドル-3-イル)エチル)アミノ)プロパン酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.84分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V): 611 (M+H)<sup>+</sup>。

25 実施例 4 (6)



3- (N- ( (2- (2- ( (ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (1H-インドール-3-イル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 3.23 分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 547 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (7)

10 3- (N- ( (2- (2- ( (ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (1H-インドール-3-イル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.18 分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 547 (M+H)<sup>+</sup>。

15

#### 実施例 4 (8)

3- (N- ( (2- (2- ( (ピリジン-4-イルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (1H-インドール-3-イル) エチル) アミノ) プロパノ酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.14 分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 547 (M+H)<sup>+</sup>, 439。

#### 実施例 4 (9)

25 3- (N- ( (2- (2- ( (1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-

(1H-インドール-3-イル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.78 分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 572 (M+H)<sup>+</sup>。

5

#### 実施例 4 (10)

3- (N- ( (2- (2- ( (α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (1H-インドール-3-イル) エチル) アミノ) プロパノ酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.80 分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 560 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (11)

15 3- (N- ( (2- (2- ( (ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (1H-インドール-3-イル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.73 分;

20 MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 546 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (12)

25 3- (N- ( (2- (2- ( (2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (1H-インドール-3-イル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間：3.75分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 576 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (13)

- 5 3-(N-(2-(2-メチルベンジルアミノ)カルボニル)フ  
エニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(1H-インドール-3-イ  
ル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.80分；

- 10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 560 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (14)

- 3-(N-(2-(2-(3-メトキシベンジルアミノ)カルボニル)  
フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(1H-インドール-3-  
イル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.73分；

- MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 576 (M+H)<sup>+</sup>。

20 実施例 4 (15)

- 3-(N-(2-(2-(4-クロロベンジルアミノ)カルボニル)フ  
エニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(1H-インドール-3-イ  
ル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

- 25 HPLC保持時間：3.86分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 580 (M+H)<sup>+</sup>, 214。

実施例 4 (16)

- 5 3-(N-(2-(2-(4-メトキシベンジルアミノ)カルボニル)  
フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(1H-インドール-3-  
イル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.71分；

- MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 576 (M+H)<sup>+</sup>。

10 実施例 4 (17)

- 3-(N-(2-(2-(4-メチルベンジルアミノ)カルボニル)フ  
エニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(1H-インドール-3-イ  
ル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

- 15 HPLC保持時間：3.82分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 560 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (18)

- 3-(N-(2-(2-(N-メチル-N-ベンジルアミノ)カルボニ  
ル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(1H-インドール-  
3-イル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.77分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 560 (M+H)<sup>+</sup>。

25

実施例 4 (19)

3- (N- ( (2- (2- (N-イソプロピル-N-ベンジルアミノ) カ  
ルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (1H-イン  
ドール-3-イル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 3.91分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 588 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (20)

3- (N- ( (2- (2- (N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボ  
ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (1H-イン  
ドール-3-イル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.84分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 574 (M+H)<sup>+</sup>, 360。

15

#### 実施例 4 (21)

3- (N- ( (2- (2- (N-ブチル-N-ベンジルアミノ) カルボ  
ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (1H-イン  
ドール-3-イル) エチル) アミノ) プロパン酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.02分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 602 (M+H)<sup>+</sup>, 388, 214。

#### 実施例 4 (22)

25 3- (N- ( (2- (2- (4- (tert-ブチル) ベンジルアミノ) カルボ  
ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (1H-イン  
ドール-

3-イル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.02分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 602 (M+H)<sup>+</sup>。

5

#### 実施例 4 (23)

3- (N- ( (2- (2- ( (5-メチル-2-フリル) メチルアミノ)   
カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (1H-イン  
ドール-3-イル) エチル) アミノ) プロパン酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.71分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 550 (M+H)<sup>+</sup>, 214。

#### 実施例 4 (24)

15 3- (N- ( (2- (2- ( (1-フェニル-3-トリフルオロアセトキシ  
プロピルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2  
- (1H-インドール-3-イル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.98分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 686 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (25)

25 3- (N- ( (2- (2- (2-フルオロベンジルアミノ) カルボ  
ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (1H-イン  
ドール-3-イル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間：3.77分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 564 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (2.6)

5 3-(N-(2-(2-(3-フルオロベンジルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(1H-インドル-3-イル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.77分；

10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 564 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (2.7)

3-(N-(2-(2-(2,5-ジフルオロベンジルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(1H-インドル-3-イル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.79分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 582 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (2.8)

3-(N-(2-(2-(2-(1R)-1-フエニル-2-ヒドロキシエチルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(1H-インドル-3-イル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

25 HPLC保持時間：3.58分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 576 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (2.9)

5 3-(N-(2-(2-(2-クロロベンジルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(1H-インドル-3-イル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.84分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 580 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (3.0)

10 3-(N-(2-(2-(4-フルオロベンジルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(1H-インドル-3-イル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

15 HPLC保持時間：3.75分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 564 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (3.1)

3-(N-(2-(2-(2-(トリルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(1H-インドル-3-イル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.56分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 496 (M+H)<sup>+</sup>。

25

#### 実施例 4 (3.2)

3- (N- ( (2- (2- ( (2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ  
ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (1H-インドール  
-3-イル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 3.71分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 582 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例4 (33)

3- (N- ( (2- (2- ( (3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フェ  
ニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (1H-インドール-3-イ  
ル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 580 (M+H)<sup>+</sup>。

15

#### 実施例4 (34)

3- (N- ( (2- (2- ( ( (1S) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ  
チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-  
(1H-インドール-3-イル) エチル) アミノ) プロパノ酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.58分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 576 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例4 (35)

25 3- (N- ( (2- (2- ( ( (1R) -1- (4-メチルフェニル) エチ  
ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (1

H-インドール-3-イル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.88分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 574 (M+H)<sup>+</sup>。

5

#### 実施例4 (36)

3- (N- ( (2- (2- ( (1- (4-フルオロフェニル) エチルアミノ)  
カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (1H-イン  
ドール-3-イル) エチル) アミノ) プロパノ酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.82分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 578 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例4 (37)

15 3- (N- ( (2- (2- ( (2-チエニルメチルアミノ) カルボニル) フェ  
ニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (1H-インドール-3-イ  
ル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.71分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 552 (M+H)<sup>+</sup>, 214。

#### 実施例4 (38)

3- (N- ( (2- (2- ( ( (3S) -3-ヒドロキシメチル-1, 2,  
3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル) フェニル) フェ  
ニル) カルボニル) -N- (2- (1H-インドール-3-イル) エチル)  
アミノ) プロパノ酸

25

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.48分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 602 (M+H)<sup>+</sup>；

HPLC保持時間：3.62分；

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 602 (M+H)<sup>+</sup>, 498。

#### 実施例4 (39)

3- (N- ( (2- (2- (3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (1H-インドール-3-イ  
ル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.82分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 560 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例4 (40)

3- (N- ( (2- (2- (3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ  
ニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (1H-インドール  
-3-イル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件：A

20 HPLC保持時間：3.82分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 582 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例4 (41)

3- (N- ( (2- (2- (N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2  
-イル) メチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -  
N- (2- (1H-インドール-3-イル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.22分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 575 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例4 (42)

3- (N- ( (2- (2- (N- (2- (N, N-ジメチルアミノ) エチ  
ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) カルボニル)  
-N- (2- (1H-インドール-3-イル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件：A

10 HPLC保持時間：3.44分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 617 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例4 (43)

3- (N- ( (2- (2- (2-フエニルエチルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (1H-インドール-3-イ  
ル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.78分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 560 (M+H)<sup>+</sup>。

20

#### 実施例4 (44)

3- (N- ( (2- (2- (1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチ  
ルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2,  
3-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

25 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.95分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (4.5)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (N-ベンジル-N- (2-ヒドロキシエチル) アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 3-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.64分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 611 (M+H)<sup>+</sup>.

10

実施例 4 (4.6)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (2-トリルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 3-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.69分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)<sup>+</sup>.

15

実施例 4 (4.7)

- 20 3- (N- ( (2- (2- ( (1-インドラジン) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 3-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.89分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)<sup>+</sup>.

25

実施例 4 (4.8)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (1-ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 3-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.95分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 617 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (4.9)

- 10 3- (N- ( (2- (2- ( (ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 3-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.23分;

15 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 568 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (5.0)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 3-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.18分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 568 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (5.1)

- 25 3- (N- ( (2- (2- ( (1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン

—2-イル) カルボニル) フエニル) カルボニル) —N— (2-  
(2, 3-ジメトキシフエニル) エチル) テミノ) フロバベン

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.84分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (5.2)

3— (N— ( (2— (2— ( (α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) —N— (2— (2, 3-ジメトキシフエニ  
ル) エチル) テミノ) フロバベン

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>.

15 実施例 4 (5.3)

3— (N— ( (2— (2— ( (ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フ  
エニル) カルボニル) —N— (2— (2, 3-ジメトキシフエニル) エチル)  
テミノ) フロバベン

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.80分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (5.4)

3— (N— ( (2— (2— ( (2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)  
フエニル) フエニル) カルボニル) —N— (2— (2, 3-ジメトキシフエ  
ニル) エチル) テミノ) フロバベン

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.80分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 597 (M+H)<sup>+</sup>.

5 実施例 4 (5.5)

3— (N— ( (2— (2— ( (2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) —N— (2— (2, 3-ジメトキシフエニ  
ル) エチル) テミノ) フロバベン

HPLC測定条件: A

10 HPLC保持時間: 3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (5.6)

3— (N— ( (2— (2— ( (3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)  
フエニル) フエニル) カルボニル) —N— (2— (2, 3-ジメトキシフエ  
ニル) エチル) テミノ) フロバベン

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.77分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 597 (M+H)<sup>+</sup>.

20

実施例 4 (5.7)

3— (N— ( (2— (2— ( (4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) —N— (2— (2, 3-ジメトキシフエニ  
ル) エチル) テミノ) フロバベン

25 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.93分;



MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 601 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (5.8)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 3-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.77 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 597 (M+H)<sup>+</sup>.

10

実施例 4 (5.9)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 3-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.88 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>.

15

実施例 4 (6.0)

- 20 3- (N- ( (2- (2- ( (N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 3-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.82 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>.

25

実施例 4 (6.1)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 3-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.89 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (6.2)

- 10 3- (N- ( (2- (2- ( (N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 3-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.08 分;

15 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 623 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (6.3)

- 20 3- (N- ( (2- (2- ( (4- (tert-ブチル) ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 3-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.11 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 623 (M+H)<sup>+</sup>.

25 実施例 4 (6.4)

- 3- (N- ( (2- (2- ( ( (5-メチル-2-フリル) メチルアミノ)

カルボニル) フェニル) カルボニル) -N-(2, 3-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.77分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 571 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (6.5)

3-(N-(2-(2-(1-フェニル-3-トリフルオロアセトキシプロピル)アミノ)カルボニル)フェニル)カルボニル)-N-(2

10 -(2, 3-ジメトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.05分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 707 (M+H)<sup>+</sup>.

15 実施例 4 (6.6)

3-(N-(2-(2-(2-フルオロベンジル)アミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(2, 3-ジメトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.80分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (6.7)

3-(N-(2-(2-(3-フルオロベンジル)アミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(2, 3-ジメトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.82分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H)<sup>+</sup>.

5. 実施例 4 (6.8)

3-(N-(2-(2-(2, 5-ジフルオロベンジル)アミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(2, 3-ジメトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件: A

10 HPLC保持時間: 3.84分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 603 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (6.9)

3-(N-(2-(2-(2-(1R)-1-フェニル-2-ヒドロキシエチル)アミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(2, 3-ジメトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.62分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 597 (M+H)<sup>+</sup>.

20 実施例 4 (7.0)

3-(N-(2-(2-(2-(2-クロロベンジル)アミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(2, 3-ジメトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパノ酸

25 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.89分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 601 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (71)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 3-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.80分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H)<sup>+</sup>。

10

実施例 4 (72)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (アリルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 3-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

15

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.62分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 517 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (73)

- 20 3- (N- ( (2- (2- ( (2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 3-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.77分;

25

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 603 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (74)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 3-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

5

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.93分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 601 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (75)

- 10 3- (N- ( (2- (2- ( ( (1S) -1-フエニル-2-ヒドロキシエチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 3-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.62分;

15

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 597 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (76)

- 3- (N- ( (2- (2- ( ( (1R) -1- (4-メチルフエニル) エチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 3-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

20

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.93分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)<sup>+</sup>。

25 実施例 4 (77)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (1- (4-フルオロフエニル) エチルアミノ)

カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N-(2, 3-ジ  
メトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.89 分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 599 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (78)

3-(N-(2-(2-(2-チエニルメチルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N-(2, 3-ジメトキシフエニ  
ル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.75 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 573 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 15 実施例 4 (79)

3-(N-(2-(2-(2-(3S)-3-ヒドロキシメチル-1, 2,  
3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル) フエニル) フ  
エニル) カルボニル) -N-(2-(2, 3-ジメトキシフエニル) エチル)  
アミノ) プロパノ酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.67 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 623 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (80)

25 3-(N-(2-(2-(3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-(2, 3-ジメトキシフエニ

ル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.88 分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (81)

3-(N-(2-(2-(3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ  
ニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-(2, 3-ジメトキ  
シフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.89 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 603 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (82)

15 3-(N-(2-(2-(N-メチル-N-(6-メチルピリジン-2  
-イル) メチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -  
N-(2-(2, 3-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.22 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 596 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (83)

25 3-(N-(2-(2-(N-(N-ジメチルアミノ) エチ  
ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル)  
-N-(2-(2, 3-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間：3.45分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 638 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (84)

5 3-(N-(2-(2-フェニルエチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニルカルボニル-N-(2-(2,3-ジメトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.86分；

10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (85)

3-(N-(2-(2-(1,2,3,4-テトラヒドロ-1-ナフチルアミノ)カルボニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(ピリジン-3-イル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.22分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 548 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (86)

3-(N-(2-(2-(N-ベンジル-N-(2-ヒドロキシエチル)アミノ)カルボニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(ピリジン-3-イル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

25 HPLC保持時間：3.03分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 552 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (87)

3-(N-(2-(2-(2-フリルメチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル-N-(2-(ピリジン-3-イル)エチル)アミノ)プロパン酸

5 アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.00分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 498 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (88)

3-(N-(2-(2-(1-インドラアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル-N-(2-(ピリジン-3-イル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

15 HPLC保持時間：3.18分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 534 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (89)

3-(N-(2-(2-(1-ナフチルメチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル-N-(2-(ピリジン-3-イル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.25分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 558 (M+H)<sup>+</sup>。

25

#### 実施例 4 (90)

3- (N- ( (2- (2- ( (ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニル) アミノ) アミノ) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-3-イル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 2.72分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 509 (M+H)<sup>+</sup>, 255.

#### 実施例 4 (9.1)

3- (N- ( (2- (2- ( (ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニル) アミノ) アミノ) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-3-イル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 2.68分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 509 (M+H)<sup>+</sup>, 255.

15

#### 実施例 4 (9.2)

3- (N- ( (2- (2- ( (1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル) アミノ) アミノ) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-3-イル) エチル) アミノ) フロバノン酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.20分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 534 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (9.3)

25 3- (N- ( (2- (2- ( (α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) アミノ) アミノ) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-3-イル) エチル) アミノ) フロバノン酸

ル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.14分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)<sup>+</sup>.

5

#### 実施例 4 (9.4)

3- (N- ( (2- (2- ( (ベンジルアミノ) カルボニル) アミノ) アミノ) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-3-イル) エチル) アミノ) フロバノン酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.11分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 508 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (9.5)

15 3- (N- ( (2- (2- ( (2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) アミノ) アミノ) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-3-イル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.12分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (9.6)

25 3- (N- ( (2- (2- ( (2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) アミノ) アミノ) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-3-イル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間：3.14分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (97)

- 5 3-(N-(2-(2-(4-クロロベンジルアミノ)カルボニル)フ  
エニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(ピリジン-3-イル)エチ  
ル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.22分；

- 10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 542 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (98)

- 3-(N-(2-(2-(4-メトキシベンジルアミノ)カルボニル)  
フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(ピリジン-3-イル)エ  
チル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.09分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (99)

- 3-(N-(2-(2-(4-メチルベンジルアミノ)カルボニル)フ  
エニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(ピリジン-3-イル)エチ  
ル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.18分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (100)

- 3-(N-(2-(2-(N-メチル-N-ベンジルアミノ)カルボニ  
ル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(ピリジン-3-イル)

- 5 エチル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.18分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (101)

- 3-(N-(2-(2-(N-エチル-N-ベンジルアミノ)カルボニ  
ル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(ピリジン-3-イル)  
エチル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

- 15 HPLC保持時間：3.25分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 536 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (102)

- 3-(N-(2-(2-(N-メチル-N-ベンジルアミノ)カルボニ  
ル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(ピリジン-3-イル)  
エチル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.40分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 564 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (103)

3- (N- ( (2- (2- ( (4- (tert-ブチル) ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ビリジノ-3-イル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 3.38 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 564 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (104)

3- (N- ( (2- (2- ( (3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ビリジノ-3-イル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.12 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 526 (M+H)<sup>+</sup>.

15

#### 実施例 4 (105)

3- (N- ( (2- (2- ( (2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ビリジノ-3-イル) エチル) アミノ) プロパノ酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.14 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 544 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (106)

25 3- (N- ( (2- (2- ( ( (1R) -1-フェニル-2-ヒドロキシエチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-

(ビリジノ-3-イル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.00 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)<sup>+</sup>.

5

#### 実施例 4 (107)

3- (N- ( (2- (2- ( (2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ビリジノ-3-イル) エチル) アミノ) プロパノ酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.18 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 542 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (108)

15 3- (N- ( (2- (2- ( (4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ビリジノ-3-イル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.11 分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 526 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (109)

3- (N- ( (2- (2- ( (アリルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ビリジノ-3-イル) エチル) アミノ) プロパノ酸

25 プロパノ酸

HPLC測定条件: A



HPLC保持時間：2.92分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 458 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例4 (1110)

3-(N-(2-(2-(2, 6-ジフルオロベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(ピリジン-3-イル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.11分；

10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 544 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例4 (1111)

3-(N-(2-(2-(3-クロロベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(ピリジン-3-イル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.18分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 542 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 20 実施例4 (1112)

3-(N-(2-(2-(2-(1S)-1-フェニル-2-ヒドロキシエチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(ピリジン-3-イル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

25 HPLC保持時間：2.98分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例4 (1113)

3-(N-(2-(2-(2-(1R)-1-(4-メチルフェニル)エチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(ピリジン-3-イル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.23分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 536 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 10 実施例4 (1114)

3-(N-(2-(2-(2-(1-(4-フルオロフェニル)エチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(ピリジン-3-イル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

15 HPLC保持時間：3.20分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 540 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例4 (1115)

3-(N-(2-(2-(2-(2-チエンメチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(ピリジン-3-イル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.07分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 514 (M+H)<sup>+</sup>。

25

#### 実施例4 (1116)

3- (N- (2- (2- ( (3S) -3-ヒドロキシメチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-3-イル) エチル) アミノ) フロバベンズ酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.07分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 564 (M+H)<sup>+</sup>, 283.

#### 実施例4 (1.1.7)

10 3- (N- (2- (2- (3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-3-イル) エチル) アミノ) フロバベンズ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.18分;

15 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例4 (1.1.8)

3- (N- (2- (2- (3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-3-イル) エチル) アミノ) フロバベンズ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.18分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 544 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 25 実施例4 (1.1.9)

3- (N- (2- (2- (N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2-

-イル) メチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-3-イル) エチル) アミノ) フロバベンズ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 2.74分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H)<sup>+</sup>, 432, 269.

#### 実施例4 (1.2.0)

3- (N- (2- (2- (N- (2- (N, N-ジメチルアミノ) エチル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-3-イル) エチル) アミノ) フロバベンズ酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 2.92分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 579 (M+H)<sup>+</sup>, 290, 267.

#### 15 実施例4 (1.2.1)

3- (N- (2- (2- (2-フエニルエチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-3-イル) エチル) アミノ) フロバベンズ酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.16分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例4 (1.2.2)

3- (N- (2- (2- (1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (4-メチルフエニル) エチル) アミノ) フロバベンズ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：4.08分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 561 (M+H)<sup>+</sup>。

5 実施例4 (123)

3-(N-(2-(2-(N-ベンジル-N-(2-ヒドロキシエチル)アミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(4-メチルフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

10 HPLC保持時間：3.77分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (124)

3-(N-(2-(2-(1-イソプロピル)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(4-メチルフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：4.00分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 547 (M+H)<sup>+</sup>。

20

実施例4 (125)

3-(N-(2-(2-(1-ナフチルメチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(4-メチルフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

25 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：4.08分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 571 (M+H)<sup>+</sup>。

5 実施例4 (126)

3-(N-(2-(2-(1-ピリジン-2-イルメチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(4-メチルフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.33分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)<sup>+</sup>。

10

実施例4 (127)

3-(N-(2-(2-(1-ピリジン-3-イルメチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(4-メチルフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

15 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.27分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)<sup>+</sup>。

20 実施例4 (128)

3-(N-(2-(2-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(4-メチルフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

25 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.95分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 547 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (129)

3- (N- ( (2- (2- (α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (4-メチルフエニル) エチ  
ル) アミノ) フロバノン酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.99分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 535 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (130)

10 3- (N- ( (2- (2- (β-ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フ  
エニル) カルボニル) -N- (2- (4-メチルフエニル) エチル) アミノ)  
フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.91分;

15 MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 521 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (131)

3- (N- ( (2- (2- (2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)  
フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (4-メチルフエニル) エ  
チル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.93分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (132)

3- (N- ( (2- (2- (2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (4-メチルフエニル) エチ  
ル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.00分;

5 MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 535 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (133)

10 3- (N- ( (2- (2- (3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)  
フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (4-メチルフエニル) エ  
チル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.91分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (134)

15 3- (N- ( (2- (2- (4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (4-メチルフエニル) エチ  
ル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 4.04分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 555 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (135)

25 3- (N- ( (2- (2- (4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)  
フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (4-メチルフエニル) エ  
チル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.88分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>。

5 実施例4 (136)

3-(N-(2-(2-(4-メチルベンジルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(4-メチルフエニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.99分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (137)

3-(N-(2-(2-(N-メチル-N-ベンジルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(4-メチルフエニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.95分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)<sup>+</sup>。

20

実施例4 (138)

3-(N-(2-(2-(N-メチル-N-(6-メチルピリジン-2-イル)メチルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(1-メチル-3-フエニルプロピル)アミノ)プロパン酸

25 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.34分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 564 (M+H)<sup>+</sup>。

5 実施例4 (139)

3-(N-(2-(2-(N-エチル-N-ベンジルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(4-メチルフエニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：4.02分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)<sup>+</sup>。

10

実施例4 (140)

3-(N-(2-(2-(N-メチル-N-ベンジルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(4-メチルフエニル)エチル)アミノ)プロパン酸

15 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：4.21分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (141)

20 3-(N-(2-(2-(2-(4-(tert-ブチル)ベンジルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(4-メチルフエニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：4.22分；

25 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (142)

3- (N- (2- (2- ( (5-メチル-2-フリル) メチルアミノ)  
カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メチル  
フェニル) エチル) アミノ) フロバベンソ酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.88分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 525 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (143)

10 3- (N- ( (2- (2- (1-フェニル-3-トリフルオロアセトキシ  
プロピルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2  
- (4-メチルフェニル) エチル) アミノ) フロバベンソ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.16分:

15 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 661 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (144)

3- (N- ( (2- (2- (2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メチルフェニル) エ  
チル) アミノ) フロバベンソ酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.93分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 539 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (145)

3- (N- ( (2- (2- (3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メチルフェニル) エ  
チル) アミノ) フロバベンソ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.95分:

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 539 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (146)

10 3- (N- ( (2- (2- (2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ  
ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メチルフェニ  
ル) エチル) アミノ) フロバベンソ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.97分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (147)

15 3- (N- ( (2- (2- ( (1R) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ  
チルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-  
(4-メチルフェニル) エチル) アミノ) フロバベンソ酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.77分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (148)

25 3- (N- ( (2- (2- (2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フェ  
ニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メチルフェニル) エチ  
ル) アミノ) フロバベンソ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：4.00分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)<sup>+</sup>。

5 実施例4 (149)

3- (N- (2- (2- (4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (4-メチルフエニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件：A

10 HPLC保持時間：3.93分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 539 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (150)

15 3- (N- (2- (2- (アリルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (4-メチルフエニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.75分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 471 (M+H)<sup>+</sup>。

20

実施例4 (151)

3- (N- (2- (2- (2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (4-メチルフエニル) エチル) アミノ) プロパン酸

25 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.89分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)<sup>+</sup>。

5 実施例4 (152)

3- (N- (2- (2- (3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (4-メチルフエニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：4.04分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)<sup>+</sup>。

10

実施例4 (153)

3- (N- (2- (2- ( (1S) -1-フエニル-2-ヒドロキシエチルアミノ) カルボニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (4-メチルフエニル) エチル) アミノ) プロパン酸

15

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.75分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (154)

20 3- (N- (2- (2- ( (1R) -1- (4-メチルフエニル) エチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (4-メチルフエニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：4.08分；

25

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (155)

3- (N- ( (2- (2- ( (1- (4-フルオロフェニル) エチルアミノ) フェニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メチルフェニル) エチル) アミノ) フロバベンズ酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.02分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 553 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (156)

10 3- (N- ( (2- (2- ( (2-チフェニルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メチルフェニル) エチル) アミノ) フロバベンズ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.88分:

15 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 527 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (157)

3- (N- ( (2- (2- ( (3S) -3-ヒドロキシメチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メチルフェニル) エチル) アミノ) フロバベンズ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.78分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (158)

25

3- (N- ( (2- (2- ( (3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メチルフェニル) エチル) アミノ) フロバベンズ酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.00分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (159)

10 3- (N- ( (2- (2- ( (3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メチルフェニル) エチル) アミノ) フロバベンズ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.00分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)<sup>+</sup>。

15

実施例 4 (160)

3- (N- ( (2- (2- ( (N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2-イル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メチルフェニル) エチル) アミノ) フロバベンズ酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.33分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 550 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (161)

25 3- (N- ( (2- (2- ( (N- (2- (N, N-ジメチルアミノ) エチル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル)



-N- (2- (4-メチルフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.55 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 592 (M+H)<sup>+</sup>.

5

実施例 4 (162)

3- (N- ( (2- (2-フェニルエチル) アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メチルフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.99 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (163)

15 3- (N- ( (2- (2- (1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチル) アミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.97 分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (164)

3- (N- ( (2- (2- (N-ベンジル-N- (2-ヒドロキシエチル) アミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.66 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (165)

5 3- (N- ( (2- (2- (1-ナフチル) アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.95 分;

10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 587 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (166)

3- (N- ( (2- (2- (α-メチルベンジル) アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.88 分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (167)

3- (N- ( (2- (2- (2-メチルベンジル) アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

25 HPLC保持時間: 3.88 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (168)

3- (N- ( (2- (2- ( (4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシフエニル) エ

5 チル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.91分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 571 (M+H)<sup>+</sup>.

10 実施例 4 (169)

3- (N- ( (2- (2- ( (4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)  
フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシフエニル)

エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

15 HPLC保持時間: 3.77分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (170)

20 3- (N- ( (2- (2- ( (N- (4-フロロピリル) -N-ベンジルアミノ)  
カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキ

シフエニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.97分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 579 (M+H)<sup>+</sup>, 571.

25 実施例 4 (171)

3- (N- ( (2- (2- ( (N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ  
ル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシフエニ  
ル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 3.89分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)<sup>+</sup>.

10 実施例 4 (172)

3- (N- ( (2- (2- ( (N-アチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ  
ル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシフエニ  
ル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.10分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)<sup>+</sup>.

15

実施例 4 (173)

3- (N- ( (2- (2- ( (4- (tert-アチル) ベンジルアミノ) カルボニ  
ル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシフエニ  
ル) エチル) アミノ) フロバノン酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.11分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)<sup>+</sup>.

25 実施例 4 (174)

3- (N- ( (2- (2- ( ( (5-メチル-2-フリル) メチルアミノ)  
カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキ

シジフェニル) エチル) テミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.78分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 541 (M+H)<sup>+</sup>.

5

実施例 4 (175)

3- (N- ( (2- (2- ( (1-フェニル-3-トリフルオロアセトキシ  
プロピル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2  
- (3-メトキシフェニル) エチル) テミノ) プロパン酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.04分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 699 (M+Na)<sup>+</sup>, 677 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (176)

15 3- (N- ( (2- (2- ( (2, 5-ジフルオロベンジル) カルボ  
ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシフェ  
ニル) エチル) テミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.84分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 573 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (177)

25 3- (N- ( (2- (2- ( ( (1R) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ  
チル) テミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-  
(3-メトキシフェニル) エチル) テミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.62分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (178)

5 3- (N- ( (2- (2- ( (2-クロロベンジル) カルボニル) フ  
エニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシフェニル) エ  
チル) テミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.91分;

10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 571 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (179)

15 3- (N- ( (2- (2- ( (4-フルオロベンジル) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシフェニル)  
エチル) テミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.82分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (180)

20 3- (N- ( (2- (2- ( (3-クロロベンジル) カルボニル) フ  
エニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシフェニル) エ  
チル) テミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

25 HPLC保持時間: 3.93分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 571 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (181)

- 3- (N- ( (2- ( (1S) -1-フェニル-2-ヒドロキシエチルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.62分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)<sup>+</sup>.

10 実施例 4 (182)

3- (N- ( (2- ( (1R) -1- (4-メチルフェニル) エチルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

- 15 HPLC保持時間: 3.95分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (183)

- 20 3- (N- ( (2- ( (1- (4-フルオロフェニル) エチルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.89分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 569 (M+H)<sup>+</sup>.

25 実施例 4 (184)

3- (N- ( (2- ( ( (3S) -3-ヒドロキシメチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

- 5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.67分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (185)

- 10 3- (N- ( (2- ( (3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.88分;

- 15 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)
- <sup>+</sup>
- .

実施例 4 (186)

- 3- (N- ( (2- ( (3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.88分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 573 (M+H)<sup>+</sup>.

25 実施例 4 (187)

3- (N- ( (2- ( (N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2

ーイル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -  
N-(2-(3-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.23分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 566 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (188)

3-(N-(2-(2-(N-(2-(N,N-ジメチルアミノ) エチ  
ル)-N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル)

10 -N-(2-(3-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.45分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 608 (M+H)<sup>+</sup>。

15 実施例 4 (189)

3-(N-(2-(2-(2-フェニルエチルアミノ) カルボニル) フェ  
ニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-メトキシフェニル) エ  
チル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (190)

25 3-(N-(2-(2-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチ  
ルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-  
-フェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.93分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 553 (M+H)<sup>+</sup>。

5 実施例 4 (191)

3-(N-(2-(2-(N-ベンジル-N-(2-ヒドロキシエチル)  
アミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-  
-フェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

10 HPLC保持時間: 3.62分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (192)

15 3-(N-(2-(2-(2-フリルメチルアミノ) カルボニル) フェ  
ニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-フェニル) エチル) ア  
ミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.67分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 503 (M+H)<sup>+</sup>。

20

実施例 4 (193)

3-(N-(2-(2-(1-イソダントアミノ) カルボニル) フェニル)  
フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-フェニル) エチル) アミノ) プ  
ロパン酸

25 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 539 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (194)

- 3- (N- ( (2- (2- (1-ナチルメチルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2-チエニル) エチル) ア  
ミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.95 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 563 (M+H)<sup>+</sup>。

10

実施例 4 (195)

- 3- (N- ( (2- (2- (ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニ  
ル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2-チエニル) エチ  
ル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.22 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 514 (M+H)<sup>+</sup>。

15

実施例 4 (196)

- 20 3- (N- ( (2- (2- (ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニ  
ル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2-チエニル) エチ  
ル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.14 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 514 (M+H)<sup>+</sup>。

25

実施例 4 (197)

- 3- (N- ( (2- (2- (1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン  
-2-イル) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2-  
(2-チエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.82 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 539 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (198)

- 10 3- (N- ( (2- (2- (α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2-チエニル) エチル) ア  
ミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.86 分;

15 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 527 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (199)

- 20 3- (N- ( (2- (2- (ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フ  
エニル) カルボニル) -N- (2- (2-チエニル) エチル) アミノ) プロ  
パノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.79 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 513 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (200)

- 25 3- (N- ( (2- (2- (2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-チエニル) エチル)

アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.78分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 543 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (201)

3-(N-(2-(2-(2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-チエニル) エチル) ア

10 ミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.84分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 527 (M+H)<sup>+</sup>。

15 実施例4 (202)

3-(N-(2-(2-(3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フ

エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-チエニル) エチル)

アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.77分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 543 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (203)

3-(N-(2-(2-(4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

25 エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-チエニル) エチル) ア

ミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.89分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 547 (M+H)<sup>+</sup>。

5 実施例4 (204)

3-(N-(2-(2-(4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-チエニル) エチル)

アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

10 HPLC保持時間: 3.73分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 543 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (205)

3-(N-(2-(2-(4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

15 エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-チエニル) エチル) ア

ミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 527 (M+H)<sup>+</sup>。

20

実施例4 (206)

3-(N-(2-(2-(N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニル)

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-チエニル) エチ

ル) アミノ) フロバベン酸

25 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.80分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 527 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (207)

- 3- (N- ( (2- (2- (N- (1-プロピル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-チエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.93分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)<sup>+</sup>。

10

実施例 4 (208)

- 3- (N- ( (2- (2- (N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-チエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.88分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 541 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (209)

- 20 3- (N- ( (2- (2- (N-ブチル-N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-チエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.08分:

25 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 569 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (210)

- 3- (N- ( (2- (2- (4- (tert-ブチル) -ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-チエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.10分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 569 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (211)

- 10 3- (N- ( (2- (2- (1-フェニル-3-ヒドロキシプロピルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-チエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.60分:

15 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (212)

- 3- (N- ( (2- (2- (2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-チエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.80分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 531 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (213)

- 25 3- (N- ( (2- (2- (3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)



フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-チエニル) エチル)

アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.80分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 531 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (2.1.4)

3-(N-(2-(2-(2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-チエニル) エ

10 チル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.82分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)<sup>+</sup>。

15 実施例4 (2.1.5)

3-(N-(2-(2-(2-(1R) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ

チルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-

(2-チエニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.60分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 543 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (2.1.6)

3-(N-(2-(2-(2-(2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

25 エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-チエニル) エチル) ア

ミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.16分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 542 (M+H)<sup>+</sup>。

5 実施例4 (2.1.7)

3-(N-(2-(2-(2-(4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-チエニル) エチル)

アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

10 HPLC保持時間: 3.78分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 531 (M+H)<sup>+</sup>, 156。

実施例4 (2.1.8)

3-(N-(2-(2-(2-(アリルアミノ) カルボニル) フェニル) フェ

15 ニル) カルボニル) -N-(2-(2-チエニル) エチル) アミノ) フロバ

ノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.62分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 463 (M+H)<sup>+</sup>。

20

実施例4 (2.1.9)

3-(N-(2-(2-(2-(2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2-チエニル) エ

チル) アミノ) フロバノン酸

25 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.78分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (220)

- 3 - (N- ( (2- (2- (3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-チエニル) エチル) ア  
ミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件 : A

HPLC保持時間 : 3.91 分 :

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 547 (M+H)<sup>+</sup>.

10

実施例 4 (221)

- 3 - (N- ( (2- (2- ( (1S) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ  
チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-  
(2-チエニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件 : A

HPLC保持時間 : 3.62 分 :

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 543 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (222)

- 20 3 - (N- ( (2- (2- ( (1R) -1- (4-メチルフェニル) エチ  
ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2  
-チエニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件 : A

HPLC保持時間 : 3.93 分 :

25 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 541 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (223)

- 3 - (N- ( (2- (2- ( (1- (4-フルオロフェニル) エチルアミノ)  
カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-チエニ  
ル) エチル) アミノ) フロバノン酸

5 HPLC測定条件 : A

HPLC保持時間 : 3.89 分 :

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 545 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (224)

- 10 3 - (N- ( (2- (2- ( (2-チエニルメチルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-チエニル) エチル) ア  
ミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件 : A

HPLC保持時間 : 3.75 分 :

15 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 519 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (225)

- 3 - (N- ( (2- (2- ( (3S) -3-ヒドロキシメチル-1, 2,  
3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル) フェニル) フ  
エニル) カルボニル) -N- (2- (2-チエニル) エチル) アミノ) フロ  
バノン酸

HPLC測定条件 : A

HPLC保持時間 : 3.63 分 :

25 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 569 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (226)

3- (N- ( (2- (2- (3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ  
 エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2-チエニル) エチル) ア  
 ミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 527 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (2.2.7)

3- (N- ( (2- (2- (3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ  
 ニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2-チエニル) エ  
 チル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)<sup>+</sup>.

15

#### 実施例 4 (2.2.8)

3- (N- ( (2- (2- (N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2  
 -イル) メチルアミノ) カルボニル) フエニル) カルボニル) -  
 N- (2- (2-チエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.20分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 542 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (2.2.9)

25 3- (N- ( (2- (2- (N- (N- (N-ジメチルアミノ) エチ  
 ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) カルボニル)

-N- (2- (2-チエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.44分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 584 (M+H)<sup>+</sup>.

5

#### 実施例 4 (2.3.0)

3- (N- ( (2- (2- (2-フェニルエチルアミノ) カルボニル) フ  
 エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2-チエニル) エチル) ア  
 ミノ) プロパノ酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 527 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (2.3.1)

15 3- (N- ( (2- (2- (1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチ  
 ルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (ピリジ  
 ン-3-イルメチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.23分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 534 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (2.3.2)

25 3- (N- ( (2- (2- (N-ベンジル-N- (2-ヒドロキシエチル)  
 アミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (ピリジ  
 ン-3-イルメチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間：3.07分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (233)

- 5 3-(N-(2-(2-(1-ナフチルメチルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)アミノプロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.25分；

- 10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 544 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (234)

- 3-(N-(2-(2-(ピリジン-2-イルメチルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)アミノプロパン酸

- 15 アミノプロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：2.70分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 989 (2M+H)<sup>+</sup>, 495 (M+H)<sup>+</sup>, 248。

- 20 実施例 4 (235)

- 3-(N-(2-(2-(ピリジン-4-イルメチルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)アミノプロパン酸

HPLC測定条件：A

- 25 HPLC保持時間：2.70分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 989 (2M+H)<sup>+</sup>, 495 (M+H)<sup>+</sup>, 248。

実施例 4 (236)

- 3-(N-(2-(2-(α-メチルベンジルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)アミノプロパン酸

- 5 アミノプロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.16分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 508 (M+H)<sup>+</sup>。

- 10 実施例 4 (237)

- 3-(N-(2-(2-(2-メチルベンジルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)アミノプロパン酸

HPLC測定条件：A

- 15 HPLC保持時間：3.16分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 508 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (238)

- 20 3-(N-(2-(2-(4-クロロベンジルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)アミノプロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.23分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 528 (M+H)<sup>+</sup>。

- 25

実施例 4 (239)

3- (N- ( (2- (2- (N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ピリジン-3-イルメチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 3.25分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (2.4.0)

10 3- (N- ( (2- (2- (N-アチル-N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ピリジン-3-イルメチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.42分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 550 (M+H)<sup>+</sup>.

15

実施例 4 (2.4.1)

3- (N- ( (2- (2- (4- (tert-ブチル) ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ピリジン-3-イルメチル) アミノ) プロパン酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.42分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 550 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (2.4.2)

25 3- (N- ( (2- (2- (1-フェニル-3-ヒドロキシプロピルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ピリジン-3

-イルメチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.01分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)<sup>+</sup>.

5

実施例 4 (2.4.3)

3- (N- ( (2- (2- (2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ピリジン-3-イルメチル) アミノ) プロパン酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.14分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 530 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (2.4.4)

15 3- (N- ( (2- (2- ( (1R) -1-フェニル-2-ヒドロキシエチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ピリジン-3-イルメチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.00分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 524 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (2.4.5)

3- (N- ( (2- (2- (2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ピリジン-3-イルメチル) アミノ) プロパン酸

25 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間 : 3.20 分 ;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 528 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (246)

- 5 3-(N-(2-(3-クロロベンジルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件 : A

HPLC保持時間 : 3.23 分 ;

- 10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 528 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (247)

- 3-(N-(2-(2-(1S)-1-フエニル-2-ヒドロキシエチルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件 : A

HPLC保持時間 : 3.00 分 ;

- MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 524 (M+H)<sup>+</sup>。

20 実施例 4 (248)

- 3-(N-(2-(2-(1R)-1-(4-メチルフエニル)エチルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件 : A

- 25 HPLC保持時間 : 3.23 分 ;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (249)

- 5 3-(N-(2-(2-(1-(4-フルオロフエニル)エチルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件 : A

HPLC保持時間 : 3.20 分 ;

- MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 526 (M+H)<sup>+</sup>。

10 実施例 4 (250)

- 3-(N-(2-(2-(3S)-3-ヒドロキシメチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル)カルボニル)フエニル)カルボニル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)アミノ)プロパン酸

- 15 HPLC測定条件 : A

HPLC保持時間 : 3.09 分 ;

- MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 550 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (251)

- 20 3-(N-(2-(2-(3-メチルベンジルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件 : A

HPLC保持時間 : 3.17 分 ;

- 25 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 508 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (2.5.2)

3- (N- ( (2- (2- ( (3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ピリジン-3-イルメチル) アミノ) フロバノン酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.20分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 530 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (2.5.3)

10 3- (N- ( (2- (2- ( (N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2-イル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (ピリジン-3-イルメチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 2.76分;

15 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 523 (M+H)<sup>+</sup>, 262.

実施例 4 (2.5.4)

3- (N- ( (2- (2- ( (N- (2- (N, N-ジメチルアミノ) エチル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (ピリジン-3-イルメチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 2.94分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)<sup>+</sup>, 283.

実施例 4 (2.5.5)

25 3- (N- ( (2- (2- ( (2-フェニルエチルアミノ) カルボニル) フ

フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ピリジン-3-イルメチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.18分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 508 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (2.5.6)

3- (N- ( (2- (2- ( (1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-フェニル) フロバノン酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.04分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 561 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (2.5.7)

3- (N- ( (2- (2- ( (N-ベンジル-N- (2-ヒドロキシエチル) アミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-フェニル) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.73分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (2.5.8)

3- (N- ( (2- (2- ( (2-フリルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-フェニル) フロバノン酸

25 フロバノン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.78分；

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 511 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 5 実施例4 (2.5.9)

3-(N-(2-(2-(1-イソタンジニル)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-フェニルプロピル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

10 HPLC保持時間：3.99分；

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 547 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例4 (2.6.0)

3-(N-(2-(2-(1-ナフチルメチルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-フェニルプロピル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：4.06分；

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 571 (M+H)<sup>+</sup>。

20

#### 実施例4 (2.6.1)

3-(N-(2-(2-(2-ピリジン-2-イルメチルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-フェニルプロピル)アミノ)プロパン酸

25 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.29分；

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 522 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 5 実施例4 (2.6.2)

3-(N-(2-(2-(2-ピリジン-3-イルメチルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-フェニルプロピル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.23分；

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 522 (M+H)<sup>+</sup>。

10

#### 実施例4 (2.6.3)

3-(N-(2-(2-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-フェニルプロピル)アミノ)プロパン酸

15 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.95分；

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 547 (M+H)<sup>+</sup>。

20

#### 実施例4 (2.6.4)

3-(N-(2-(2-( $\alpha$ -メチルベンジルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-フェニルプロピル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.97分；

25 MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 535 (M+H)<sup>+</sup>。



実施例 4 (265)

3- (N- (2- (2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2-フエニルプロピル) アミノ) フロバベン酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.89 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (266)

10 3- (N- (2- (2- (2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2-フエニルプロピル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.95 分;

15 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (267)

3- (N- (2- (2- (3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2-フエニルプロピル) アミノ) フロバベン酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.86 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (268)

3- (N- (2- (2- (4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ

エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2-フエニルプロピル) アミノ) フロバベン酸

フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.01 分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (269)

3- (N- (2- (2- (4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2-フエニルプロピル) アミノ) フロバベン酸

10 フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.84 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (270)

3- (N- (2- (2- (4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2-フエニルプロピル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.99 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (271)

3- (N- (2- (2- (N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2-フエニルプロピル) アミノ) フロバベン酸

25

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.93分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)<sup>+</sup>。

5 実施例4 (272)

3-(N-(2-(2-(N-エチル-N-ベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-フェニルプロピル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

10 HPLC保持時間：4.00分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (273)

3-(N-(2-(2-(N-ブチル-N-ベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-フェニルプロピル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：4.19分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)<sup>+</sup>。

20

実施例4 (274)

3-(N-(2-(2-(4-(tert-ブチル)ベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-フェニルプロピル)アミノ)プロパン酸

25 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：4.22分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)<sup>+</sup>。

5 実施例4 (275)

3-(N-(2-(2-(1-フェニル-3-トリフルオロアセトキシプロピルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-フェニルプロピル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：4.13分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 661 (M+H)<sup>+</sup>。

10

実施例4 (276)

3-(N-(2-(2-(2-フルオロベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-フェニルプロピル)アミノ)プロパン酸

15 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.91分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 539 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (277)

20 3-(N-(2-(2-(3-フルオロベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-フェニルプロピル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.93分；

25 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 539 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (278)

3- (N- ( (2- (2- ( (2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-フェニルプロピル) アミノ) プロパノ酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.93 分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (279)

10 3- (N- ( (2- (2- ( (1R) -1-フェニル-2-ヒドロキシエチルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-フェニルプロピル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.71 分:

15 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (280)

3- (N- ( (2- (2- (2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-フェニルプロピル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.00 分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (281)

3- (N- ( (2- (2- (4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-フェニルプロピル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.91 分:

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 539 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (282)

3- (N- ( (2- (2- ( (2R) -2-フェニル) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-フェニルプロピル) アミノ) プロパノ酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.73 分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 471 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (283)

15 3- (N- ( (2- (2- ( (2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-フェニルプロピル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.88 分:

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (284)

3- (N- ( (2- (2- ( (3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-フェニルプロピル) アミノ) プロパノ酸

25 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間：4.00分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 553 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例4 (285)

5 3-(N-(2-(2-((1S)-1-フェニル-2-ヒドロキシエチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-フェニルプロピル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.71分；

10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例4 (286)

3-(N-(2-(2-((1R)-1-(4-メチルフェニル)エチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-フェニルプロピル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：4.04分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例4 (287)

3-(N-(2-(2-((1-(4-フルオロフェニル)エチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-フェニルプロピル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

25 HPLC保持時間：3.97分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 553 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例4 (288)

3-(N-(2-(2-(2-チエニルメチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-フェニルプロピル)アミノ)プロパン酸

5 プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.86分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 527 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例4 (289)

3-(N-(2-(2-((3S)-3-ヒドロキシメチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-フェニルプロピル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

15 HPLC保持時間：3.58分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)<sup>+</sup>；

HPLC保持時間：3.75分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)<sup>+</sup>, 473。

#### 実施例4 (290)

3-(N-(2-(2-((3-メチルベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-フェニルプロピル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

25 HPLC保持時間：3.97分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (291)

3- (N- (2- (2- (3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ  
ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-フェニルプロピル)

5 アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.97 分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)<sup>+</sup>.

10 実施例 4 (292)

3- (N- (2- (2- (N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2  
-イル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -  
N- (2-フェニルプロピル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

15 HPLC保持時間: 3.29 分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 550 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (293)

3- (N- (2- (2- (N- (2- (N, N-ジメチルアミノ) エチ  
ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル)

20 -N- (2-フェニルプロピル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.51 分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 592 (M+H)<sup>+</sup>.

25 実施例 4 (294)

3- (N- (2- (2- (2-フェニルエチルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-フェニルプロピル) アミノ)  
プロパン酸

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 3.95 分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (295)

10 3- (N- (2- (2- (1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチ  
ルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピ  
リジン-2-イル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.25 分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 548 (M+H)<sup>+</sup>.

15

実施例 4 (296)

3- (N- (2- (2- (N-ベンジル-N- (2-ヒドロキシエチル)  
アミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピ  
リジン-2-イル) エチル) アミノ) プロパン酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.07 分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 552 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (297)

25 3- (N- (2- (2- (1-ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-2-イル) エチ

ル) アミノ) フロバベン

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.27分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 558 (M+H)<sup>+</sup>。

5

実施例 4 (298)

3- (N- ( (2- (2- (α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (β) ジン-2-イル) エチ  
ル) アミノ) フロバベン

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.18分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (299)

15 3- (N- ( (2- (2- (2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (β) ジン-2-イル) エチ  
ル) アミノ) フロバベン

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.18分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (300)

3- (N- ( (2- (2- (4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (β) ジン-2-イル) エチ  
ル) アミノ) フロバベン

25 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.23分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 542 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (301)

5 3- (N- ( (2- (2- (N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ  
ル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (β) ジン-2-イル)  
エチル) アミノ) フロバベン

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.29分;

10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 536 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (302)

3- (N- ( (2- (2- (N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ  
ル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (β) ジン-2-イル)  
エチル) アミノ) フロバベン

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.45分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 564 (M+H)<sup>+</sup>。

20 実施例 4 (303)

3- (N- ( (2- (2- (4- (tert-ブチル) ベンジルアミノ) カルボニ  
ル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (β) ジン-2-イル)  
エチル) アミノ) フロバベン

HPLC測定条件: A

25 HPLC保持時間: 3.42分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 564 (M+H)<sup>+</sup>。

### 實施例 4 (304)

3- (N- (2- (2- ( (5-メチル-2-フリル) メチルアミノ)  
カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジノ-  
2-イル) エチル) アミノ) フロバノール

HPLC测定条件：A

HPLC保持時間：3.11分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 512 (M+H)<sup>+</sup>。

10 寒施例 4 (305)

3-(N-(2-(2-(1-フェニル-3-ヒドロキシプロピルアミ  
ノ)カルボニル)フェニル)フェニル)-N-(2-(ピリジ  
ン-2-イル)エチル)アミン)プロパノ酸

HPLC测定条件: A

15 HPLC保持時間：3.01分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 552 (M+H)<sup>+</sup>。

實施例 4 (306)

3- (N- (2- (2, 5-ジフルオロペンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-2-イル) エチル) アミノ) プロペン酸

HPLC测定条件: A

HPLC保持時間: 3.16分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 544 (M+H)<sup>+</sup>。

實施例 4 (307)

3-(N-(2-(2-(1R)-1-フェニル-2-ヒドロキシ  
 チルアミ))カルボニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-  
 (ヒリジン-2-イル)エチル)アミ)プロパノ酸

HPLC测定条件：A

5 HPLC保持時間：3.00分；

MAS S<sup>+</sup> (ESI, Pos., 20V) : 538 (M + H)<sup>+</sup>。

### 實施例 4 (308)

3- (N- (2- (3-クロロベンジルアミノ) カルボニル)・  
10 エニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-2-イル) エチ  
ル) アミノ) フロロベン酸

HPLC测定条件：A

HPLC保持時間：3.22分；

MASSデータ (ESI, pos., 20V) : 542 (M+H)<sup>+</sup>。

### 实例 4 (309)

3-N-(2-(2-((1S)-1-フェニル-2-ヒドロキシエチルアミノ)カルボニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(ピリジン-2-イル)エチル)アミノ)プロパノ酸

20 HPLC测定条件: A

HPLC保持時間: 3.01 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)<sup>+</sup>。

### 寒施例 4 (310)

25 3-(N-(2-(2-((1R)-1-(4-メチルブチル)エチル)カルボニル)ブチル)カルボニル)-N-(2-(2-

リジン-2-イル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.23 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 536 (M+H)<sup>+</sup>.

5

実施例 4 (3.1.1)

3- (N- ( (2- (2- ( (1- (4-フルオロフェニル) エチルアミノ)  
カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-  
2-イル) エチル) アミノ) プロパン酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.20 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 540 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (3.1.2)

15 3- (N- ( (2- (2- ( ( (3S) -3-ヒドロキシメチル-1, 2,  
3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル) フェニル) フェ  
ニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-2-イル) エチル) アミノ)  
プロパン酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 2.96 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 564 (M+H)<sup>+</sup>, 282;

HPLC保持時間: 3.08 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 564 (M+H)<sup>+</sup>.

25 実施例 4 (3.1.3)

3- (N- ( (2- (2- ( (3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェ

ニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-2-イル) エチ  
ル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.20 分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (3.1.4)

3- (N- ( (2- (2- ( (N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2-  
イル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -  
N- (2- (ピリジン-2-イル) エチル) アミノ) プロパン酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 2.74 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H)<sup>+</sup>, 432, 269.

実施例 4 (3.1.5)

15 3- (N- ( (2- (2- ( (N- (2- (N, N-ジメチルアミノ) エチ  
ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル)  
-N- (2- (ピリジン-2-イル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 2.92 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 579 (M+H)<sup>+</sup>, 290, 267.

実施例 4 (3.1.6)

25 3- (N- ( (2- (2- ( (1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチ  
ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3,  
4-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸



HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.82分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H)<sup>+</sup>。

5 実施例4 (317)

3- (N- (2- (2- (N-ベンジル-N- (2-ヒドロキシエチル) アミノ) カルボニル) アミノ) アミノ) カルボニル) -N- (2- (3, 4-ジメトキシアミノ) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件：A

10 HPLC保持時間：3.49分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 611 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (318)

15 3- (N- (2- (2- (2-トリルメチルアミノ) カルボニル) アミノ) アミノ) カルボニル) -N- (2- (3, 4-ジメトキシアミノ) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.55分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)<sup>+</sup>。

20

実施例4 (319)

3- (N- (2- (2- (1-イソタンアミノ) カルボニル) アミノ) アミノ) カルボニル) -N- (2- (3, 4-ジメトキシアミノ) エチル) アミノ) フロバベン酸

25 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.73分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)<sup>+</sup>。

5 実施例4 (320)

3- (N- (2- (2- (1-ナフチルメチルアミノ) カルボニル) アミノ) アミノ) カルボニル) -N- (2- (3, 4-ジメトキシアミノ) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.82分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 617 (M+H)<sup>+</sup>。

10

実施例4 (321)

3- (N- (2- (2- (2-ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニル) アミノ) アミノ) カルボニル) -N- (2- (3, 4-ジメトキシアミノ) エチル) アミノ) フロバベン酸

15 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.14分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 568 (M+H)<sup>+</sup>。

20 実施例4 (322)

3- (N- (2- (2- (2-ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニル) アミノ) アミノ) カルボニル) -N- (2- (3, 4-ジメトキシアミノ) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.07分；

25 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 568 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (3.2.3)

3- (N- ( (2- (2- (1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3, 4-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパン酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.71分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)<sup>+</sup>, 358.

実施例 4 (3.2.4)

10 3- (N- ( (2- (2- (α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3, 4-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.73分;

15 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (3.2.5)

3- (N- ( (2- (2- (ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3, 4-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパン酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.64分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (3.2.6)

3- (N- ( (2- (2- (2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3, 4-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.66分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 597 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (3.2.7)

10 3- (N- ( (2- (2- (2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3, 4-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.73分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (3.2.8)

15 3- (N- ( (2- (2- (3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3, 4-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.66分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 597 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (3.2.9)

25 3- (N- ( (2- (2- (4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3, 4-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.79分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 601 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 5 実施例4 (3.3.0)

3-(N-(2-(2-(4-メトキシベンジルアミノ)カルボニル)

フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(3,4-ジメトキシフェ

ニル)エチル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

10 HPLC保持時間：3.62分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 597 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例4 (3.3.1)

3-(N-(2-(2-(4-メチルベンジルアミノ)カルボニル)

フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(3,4-ジメトキシフェ

ニル)エチル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.73分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>.

20

#### 実施例4 (3.3.2)

3-(N-(2-(2-(N-メチル-N-ベンジルアミノ)カルボニ

ル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(3,4-ジメトキシ

フェニル)エチル)アミノ)プロパノ酸

25 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.67分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>, 346.

#### 5 実施例4 (3.3.3)

3-(N-(2-(2-(N-エチル-N-ベンジルアミノ)カルボニ

ル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(3,4-ジメトキシ

フェニル)エチル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.77分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)<sup>+</sup>, 360.

10

#### 実施例4 (3.3.4)

3-(N-(2-(2-(N-ブチル-N-ベンジルアミノ)カルボニ

ル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(3,4-ジメトキシ

フェニル)エチル)アミノ)プロパノ酸

15 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.97分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 623 (M+H)<sup>+</sup>, 388.

#### 20 実施例4 (3.3.5)

3-(N-(2-(2-(4-(tert-ブチル)ベンジルアミノ)カルボニ

ル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(3,4-ジメトキシ

フェニル)エチル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.99分；

25 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 623 (M+H)<sup>+</sup>, 388.

実施例 4 (3.3.6)

3- (N- ( (2- (2- ( (1-フェニル-3-ヒドロキシプロピルアミ  
ノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3, 4  
-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.47分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 611 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (3.3.7)

10 3- (N- ( (2- (2- ( (2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3, 4-ジメトキシフェ  
ニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.67分:

15 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (3.3.8)

3- (N- ( (2- (2- ( (3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3, 4-ジメトキシフェ  
ニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.67分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (3.3.9)

3- (N- ( (2- (2- ( (2, 5-フルオロベンジルアミノ) カルボ

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3, 4-ジメトキ  
シフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.69分:

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 603 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (3.4.0)

3- (N- ( (2- (2- ( ( (1R) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ  
チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-  
(3, 4-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.49分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 597 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (3.4.1)

15 3- (N- ( (2- (2- ( (2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フェ  
ニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3, 4-ジメトキシフェ  
ニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.77分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 601 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (3.4.2)

3- (N- ( (2- (2- ( (4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3, 4-ジメトキシフェ  
ニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.67分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H)<sup>+</sup>。

5 実施例4 (343)

3- (N- (2- (2- (トリルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3, 4-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件：A

10 HPLC保持時間：3.47分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 517 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (344)

15 3- (N- (2- (2- (2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3, 4-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.66分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 603 (M+H)<sup>+</sup>。

20

実施例4 (345)

3- (N- (2- (2- (3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3, 4-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

25 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.79分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 601 (M+H)<sup>+</sup>。

5 実施例4 (346)

3- (N- (2- (2- ( (1S) -1-フェニル-2-ヒドロキシエチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3, 4-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.49分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 597 (M+H)<sup>+</sup>。

10

実施例4 (347)

3- (N- (2- (2- ( (1R) -1- (4-メチルフェニル) エチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3, 4-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

15 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.80分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (348)

20 3- (N- (2- (2- (1- (4-フルオロフェニル) エチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3, 4-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.77分；

25 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 599 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (349)

3- (N- ( (2- (2- ( (2-チエンルメチルアミノ) カルボニル) フ  
 エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3, 4-ジメトキシフエニ  
 ル) エチル) アミノ) フロバノン酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.62分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 573 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (350)

10 3- (N- ( (2- (2- ( (3S) -3-ヒドロキシメチル-1, 2,  
 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル) フエニル) フ  
 エニル) カルボニル) -N- (2- (3, 4-ジメトキシフエニル) エチル)  
 アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

15 HPLC保持時間: 3.42分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 623 (M+H)<sup>+</sup>, 388;

HPLC保持時間: 3.53分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 623 (M+H)<sup>+</sup>, 519。

20 実施例 4 (351)

3- (N- ( (2- (2- ( (3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ  
 エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3, 4-ジメトキシフエニ  
 ル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

25 HPLC保持時間: 3.73分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (352)

3- (N- ( (2- (2- ( (3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ  
 ニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3, 4-ジメトキ  
 シフエニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.75分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 603 (M+H)<sup>+</sup>。

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 603 (M+H)<sup>+</sup>。

10 実施例 4 (353)

3- (N- ( (2- (2- ( (N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2  
 -イル) メチルアミノ) カルボニル) フエニル) カルボニル) -  
 N- (2- (3, 4-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

15 HPLC保持時間: 3.11分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 596 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (354)

3- (N- ( (2- (2- ( (2-フエニルエチルアミノ) カルボニル) フ  
 エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3, 4-ジメトキシフエニ  
 ル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.71分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>。

25 実施例 4 (355)

3- (N- (2- (2- (1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (1-メチル-3-フェニルプロピル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 4.08分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 575 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (356)

3- (N- (2- (2- (N-ベンジル-N- (2-ヒドロキシエチル) アミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (1-メチル-3-フェニルプロピル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.77分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 579 (M+H)<sup>+</sup>。

15

実施例 4 (357)

3- (N- (2- (2- (1-ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (1-メチル-3-フェニルプロピル) アミノ) プロパノ酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.10分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (358)

25 3- (N- (2- (2- (α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (1-メチル-3-フェニルプロピル)

ル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.00分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)<sup>+</sup>。

5

実施例 4 (359)

3- (N- (2- (2- (2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (1-メチル-3-フェニルプロピル) アミノ) プロパノ酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.00分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (360)

15 3- (N- (2- (2- (4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (1-メチル-3-フェニルプロピル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.06分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 569 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (361)

25 3- (N- (2- (2- (3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジノ-3-イル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間：3.11分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (362)

5 3-(N-(2-(2-(N-エチル-N-ベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(1-メチル-3-フェニルプロピル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：4.06分；

10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 563 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (363)

3-(N-(2-(2-(N-メチル-N-ベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(1-メチル-3-フェニルプロピル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：4.26分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 591 (M+H)<sup>+</sup>。

20 実施例 4 (364)

3-(N-(2-(2-(4-(tert-ブチル)ベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(1-メチル-3-フェニルプロピル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

25 HPLC保持時間：4.22分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 591 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (365)

5 3-(N-(2-(2-(1-フェニル-3-ヒドロキシプロピルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(1-メチル-3-フェニルプロピル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.77分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 579 (M+H)<sup>+</sup>。

10 実施例 4 (366)

3-(N-(2-(2-(2-フルオロベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(1-メチル-3-フェニルプロピル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

15 HPLC保持時間：3.95分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 553 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (367)

20 3-(N-(2-(2-(2,5-ジフルオロベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(1-メチル-3-フェニルプロピル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.99分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 571 (M+H)<sup>+</sup>。

25

実施例 4 (368)



3- (N- ( (2- (2- ( (1R) -1-フェニル-2-ヒドロキシエチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (1-メチル-3-フェニルプロピル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 3.78分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (369)

10 3- (N- ( (2- (2- ( (2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (1-メチル-3-フェニルプロピル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.02分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 569 (M+H)<sup>+</sup>.

15

実施例 4 (370)

3- (N- ( (2- (2- ( (3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (1-メチル-3-フェニルプロピル) アミノ) プロパン酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.06分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 569 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (371)

25 3- (N- ( (2- (2- ( (1S) -1-フェニル-2-ヒドロキシエチルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (1-

メチル-3-フェニルプロピル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.75分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)<sup>+</sup>.

5

実施例 4 (372)

3- (N- ( (2- (2- ( (1R) -1- (4-メチルフェニル) エチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (1-メチル-3-フェニルプロピル) アミノ) プロパン酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.08分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 563 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (373)

15 3- (N- ( (2- (2- ( (1- (4-フルオロフェニル) エチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (1-メチル-3-フェニルプロピル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.02分:

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (374)

3- (N- ( (2- (2- ( (3S) -3-ヒドロキシメチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (1-メチル-3-フェニルプロピル) アミノ) プロパン酸

25

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.69分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 591 (M+H)<sup>+</sup>；

HPLC保持時間：3.80分；

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 591 (M+H)<sup>+</sup>, 487。

実施例4 (375)

3-(N-(2-(2-(3-メチルベンジルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(1-メチル-3-フエニルプロピル)アミノ)プロパノ酸

10 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：4.02分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)<sup>+</sup>。

15 実施例4 (376)

3-(N-(2-(2-(3, 5-ジフルオロベンジルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(1-メチル-3-フエニルプロピル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

20 HPLC保持時間：4.00分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 571 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (377)

25 3-(N-(2-(2-(N-(2-(N, N-ジメチルアミノ)エチル)-N-ベンジルアミノ)カルボニル)フエニル)カルボニル)-N-(1-メチル-3-フエニルプロピル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.60分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 606 (M+H)<sup>+</sup>。

5 実施例4 (378)

3-(N-(2-(2-(2-フエニルエチルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(1-メチル-3-フエニルプロピル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

10 HPLC保持時間：3.99分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (379)

15 3-(N-(2-(2-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(2-メトキシフエニル)エチル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：4.00分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)<sup>+</sup>。

20

実施例4 (380)

3-(N-(2-(2-(N-ベンジル-N-(2-ヒドロキシエチル)アミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(2-メトキシフエニル)エチル)アミノ)プロパノ酸

25 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.67分；

MAS Sデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (381)

- 3-(N-(2-(2-(1-イソブチルアミノ)カルボニル)フエニル)  
フエニル)カルボニル)-N-(2-(2-メトキシフエニル)エチル)ア  
ミノ)プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.97分;

MAS Sデータ (ESI, Pos., 20V) : 563 (M+H)<sup>+</sup>。

10

実施例 4 (382)

- 3-(N-(2-(2-(1-ナフチルメチルアミノ)カルボニル)フ  
エニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(2-メトキシフエニル)エ  
チル)アミノ)プロパン酸

15 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.02分;

MAS Sデータ (ESI, Pos., 20V) : 587 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (383)

- 20 3-(N-(2-(2-(ピリジン-2-イルメチルアミノ)カルボニ  
ル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(2-メトキシフエニ  
ル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.31分;

25 MAS Sデータ (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (384)

- 3-(N-(2-(2-(ピリジン-3-イルメチルアミノ)カルボニ  
ル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(2-メトキシフエニ  
ル)エチル)アミノ)プロパン酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.22分;

MAS Sデータ (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (385)

- 10 3-(N-(2-(2-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリ  
ン-2-イル)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-  
(2-メトキシフエニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.89分;

15 MAS Sデータ (ESI, Pos., 20V) : 563 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (386)

- 3-(N-(2-(2-( $\alpha$ -メチルベンジルアミノ)カルボニル)フ  
エニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(2-メトキシフエニル)エ  
チル)アミノ)プロパン酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.91分;

MAS Sデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (387)

- 25 3-(N-(2-(2-(2-メチルベンジルアミノ)カルボニル)フ

エニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-メトキシフエニル) エ  
チル) アミノ) フロバニ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.93分;

5 MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (388)

3-(N-(2-(2-(4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-メトキシフエニル) エ  
チル) アミノ) フロバニ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.99分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 571 (M+H)<sup>+</sup>。

15 実施例 4 (389)

3-(N-(2-(2-(N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ  
ル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-メトキシフエニ  
ル) エチル) アミノ) フロバニ酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.93分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 565 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (390)

3-(N-(2-(2-(N-ブチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ  
ル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-メトキシフエニ  
ル) エチル) アミノ) フロバニ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.13分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 593 (M+H)<sup>+</sup>。

5 実施例 4 (391)

3-(N-(2-(2-(4-(tert-ブチル) ベンジルアミノ) カルボニ  
ル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-メトキシフエニ  
ル) エチル) アミノ) フロバニ酸

HPLC測定条件: A

10 HPLC保持時間: 4.17分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 593 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (392)

3-(N-(2-(2-(1-フエニル-3-ヒドロキシプロピルアミ  
ノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-メ  
トキシフエニル) エチル) アミノ) フロバニ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.67分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>。

20

実施例 4 (393)

3-(N-(2-(2-(2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ  
ニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-メトキシフエ  
ニル) エチル) アミノ) フロバニ酸

25 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.89分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 573 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (394)

3- (N- (2- (2- ( (1R) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ  
チルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-  
(2-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.67分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 567 (M+H)<sup>+</sup>。

10

実施例 4 (395)

3- (N- (2- (2- (2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ  
ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-メトキシフェニル) エ  
チル) アミノ) プロパノ酸

15 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.97分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 571 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (396)

20 3- (N- (2- (2- (4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-メトキシフェニル)  
エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.86分;

25 MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 555 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (397)

3- (N- (2- (2- (2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ  
ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-メトキシフェ  
ニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.84分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 573 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (398)

10 3- (N- (2- (2- (3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ  
ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-メトキシフェニル) エ  
チル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.99分;

15 MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 571 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (399)

20 3- (N- (2- (2- ( (1S) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ  
チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-  
(2-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.69分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 567 (M+H)<sup>+</sup>。

25 実施例 4 (400)

3- (N- (2- (2- ( (1R) -1- (4-メチルフェニル) エチ

ルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-(2

-メトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.02分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例4 (4.0.1)

3-(N-(2-(2-(2-(1-(4-フルオロフエニル) エチルアミノ)

カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-(2-メトキ

シフエニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.95分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 569 (M+H)<sup>+</sup>。

15 実施例4 (4.0.2)

3-(N-(2-(2-(2-(2-チエニルメチルアミノ) カルボニル) フ

エニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-(2-メトキシフエニル) エ

チル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.82分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 543 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例4 (4.0.3)

3-(N-(2-(2-(2-(3S)-3-ヒドロキシメチル-1, 2,

3, 4-チトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル) フエニル) フ

エニル) カルボニル) -N-(2-(2-メトキシフエニル) エチル) アミ

ノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.56分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)<sup>+</sup>;

5 HPLC保持時間: 3.71分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)<sup>+</sup>, 489。

#### 実施例4 (4.0.4)

3-(N-(2-(2-(2-(3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

エニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-(2-メトキシフエニル) エ

チル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.95分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>。

15

#### 実施例4 (4.0.5)

3-(N-(2-(2-(2-(N-メチル-N-(6-メチルピリジン-2

-イル) メチルアミノ) カルボニル) フエニル) カルボニル) -

N-(2-(2-メトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.27分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 566 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例4 (4.0.6)

25 3-(N-(2-(2-(2-(N-(2-(N, N-ジメチルアミノ) エチ

ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル)

—N— (2— (2—メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.49 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 608 (M+H)<sup>+</sup>.

5

実施例 4 (407)

3— (N— ( (2— (2— ( (1, 2, 3, 4—テトラヒドロ—1—ナフチルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) —N— (4—メトキシベンジル) アミノ) プロパノ酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.89 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 563 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (408)

15 3— (N— ( (2— (2— ( (N—ベンジル—N— (2—ヒドロキシエチル) アミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) —N— (4—メトキシベンジル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.58 分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (409)

3— (N— ( (2— (2— ( (1—イソタンアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) —N— (4—メトキシベンジル) アミノ) プロパノ酸

25 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.82 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (410)

5 3— (N— ( (2— (2— ( (1—ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) カルボニル) —N— (4—メトキシベンジル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.91 分;

10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 573 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (411)

15 3— (N— ( (2— (2— ( (ピリジン—2—イルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) —N— (4—メトキシベンジル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.20 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 524 (M+H)<sup>+</sup>.

20 実施例 4 (412)

3— (N— ( (2— (2— ( (ピリジン—3—イルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) —N— (4—メトキシベンジル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

25 HPLC保持時間: 3.14 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 524 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (4.1.3)

- 3- (N- ( (2- (2- (1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (4-メトキシベンジル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.78分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)<sup>+</sup>.

10 実施例 4 (4.1.4)

- 3- (N- ( (2- (2- (α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (4-メトキシベンジル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

- 15 HPLC保持時間: 3.80分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (4.1.5)

- 20 3- (N- ( (2- (2- (ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (4-メトキシベンジル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.73分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 523 (M+H)<sup>+</sup>.

25 実施例 4 (4.1.6)

- 3- (N- ( (2- (2- (2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (4-メトキシベンジル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.73分;

- 5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 553 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (4.1.7)

- 3- (N- ( (2- (2- (2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (4-メトキシベンジル) アミノ) フロバノン酸

- 10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.82分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H)<sup>+</sup>.

15 実施例 4 (4.1.8)

- 3- (N- ( (2- (2- (3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (4-メトキシベンジル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

- 20 HPLC保持時間: 3.73分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 553 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (4.1.9)

- 25 3- (N- ( (2- (2- (4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (4-メトキシベンジル) アミノ) フロバノン酸



HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.88分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 5 実施例4 (420)

3-(N-(2-(2-(4-メトキシベンジルアミノ)カルボニル

フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(4-メトキシベンジル)アミノ

プロパノ酸

HPLC測定条件：A

10 HPLC保持時間：3.71分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 553 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例4 (421)

3-(N-(2-(2-(4-メチルベンジルアミノ)カルボニル)フ

15 エニル)フェニル)カルボニル)-N-(4-メトキシベンジル)アミノ

プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.82分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H)<sup>+</sup>。

20

#### 実施例4 (422)

3-(N-(2-(2-(N-メチル-N-ベンジルアミノ)カルボニ

ル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(4-メトキシベンジル)ア

ミノ)プロパノ酸

25 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.77分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例4 (423)

3-(N-(2-(2-(N-エチル-N-ベンジルアミノ)カルボニ

5 ル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(4-メトキシベンジル)ア

ミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.83分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>。

10

#### 実施例4 (424)

3-(N-(2-(2-(N-ブチル-N-ベンジルアミノ)カルボニ

ル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(4-メトキシベンジル)ア

ミノ)プロパノ酸

15 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：4.04分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 579 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例4 (425)

20 3-(N-(2-(2-(4-(tert-ブチル)ベンジルアミノ)カルボニ

ル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(4-メトキシベンジル)ア

ミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：4.06分；

25 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 579 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (4.2.6)

3- (N- ( (2- (2- (1-フェニル-3-ヒドロキシプロピルアミ  
ノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-メトキシ  
ベンジル) アミノ) プロパン酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.56分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 567 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (4.2.7)

10 3- (N- ( (2- (2- (2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-メトキシベンジル) アミノ)  
プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.77分;

15 MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 541 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (4.2.8)

3- (N- ( (2- (2- (3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-メトキシベンジル) アミノ)

20 プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.77分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 541 (M+H)<sup>+</sup>.

25 実施例 4 (4.2.9)

3- (N- ( (2- (2- (2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-メトキシベンジル)  
アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.78分;

5 MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 559 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (4.3.0)

10 3- (N- ( (2- (2- ( (1R) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ  
チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-  
メトキシベンジル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.56分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 553 (M+H)<sup>+</sup>.

15 実施例 4 (4.3.1)

3- (N- ( (2- (2- (2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ  
ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-メトキシベンジル) アミノ)  
プロパン酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.84分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 557 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (4.3.2)

25 3- (N- ( (2- (2- (4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-メトキシベンジル) アミノ)  
プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.75分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 541 (M+H)<sup>+</sup>。

5 実施例4 (433)

3-(N-(2-(2-(2-トリルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(4-メトキシベンジル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.56分；

10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 473 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (434)

3-(N-(2-(2-(2,6-ジフルオロベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(4-メトキシベンジル)アミノ)プロパノ酸

15 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.73分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 559 (M+H)<sup>+</sup>。

20 実施例4 (435)

3-(N-(2-(2-(3-クロロベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(4-メトキシベンジル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.85分；

25 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (436)

3-(N-(2-(2-(2-(1S)-1-フェニル-2-ヒドロキシエチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(4-メトキシベンジル)アミノ)プロパノ酸

5 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.55分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 553 (M+H)<sup>+</sup>。

10 実施例4 (437)

3-(N-(2-(2-(2-(1R)-1-(4-メチルフェニル)エチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(4-メトキシベンジル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.89分；

15 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (438)

3-(N-(2-(2-(2-(1-(4-フルオロフェニル)エチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(4-メトキシベンジル)アミノ)プロパノ酸

20 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.84分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)<sup>+</sup>。

25 実施例4 (439)

実施例4 (439)

3- (N- ( (2- (2- (2-チエンルメチルアミノ) カルボニル) フ  
 エニル) フエンル) カルボニル) -N- (4-メトキシベンジル) アミノ)  
 フロバベン酸

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 3.71 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 529 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (440)

3- (N- ( (2- ( ( (3S) -3-ヒドロキシメチル-1, 2,

10 3, 4-デトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル) フエンル) フ  
 エニル) カルボニル) -N- (4-メトキシベンジル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.49 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 579 (M+H)<sup>+</sup>;

15 HPLC保持時間: 3.62 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 579 (M+H)<sup>+</sup>, 475.

#### 実施例 4 (441)

20 3- (N- ( (2- (2- (3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ  
 エニル) フエンル) カルボニル) -N- (4-メトキシベンジル) アミノ)  
 フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.84 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (442)

3- (N- ( (2- (2- (3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ  
 ニル) フエンル) フエンル) カルボニル) -N- (4-メトキシベンジル)  
 アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 3.84 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 559 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (443)

10 3- (N- ( (2- (2- (N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2  
 -イル) メチルアミノ) カルボニル) フエンル) カルボニル) -  
 N- (4-メトキシベンジル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.18 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 552 (M+H)<sup>+</sup>.

15

#### 実施例 4 (444)

3- (N- ( (2- (2- (N- (2- (N, N-ジメチルアミノ) エチ  
 ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フエンル) カルボニル)  
 -N- (4-メトキシベンジル) アミノ) フロバベン酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.40 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 594 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (445)

25 3- (N- ( (2- (2- (2-フエンルエチルアミノ) カルボニル) フ  
 エニル) フエンル) カルボニル) -N- (4-メトキシベンジル) アミノ)

## プロパベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.80分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H)<sup>+</sup>。

5

実施例 4 (446)

3- (N- ( (2- (2- ( (1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチルアミノ) カルボニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-4-イル) エチル) アミノ) プロパベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.22分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 548 (M+H)<sup>+</sup>, 131。実施例 4 (447)

15 3- (N- ( (2- (2- ( (N-ベンジル-N- (2-ヒドロキシエチル) アミノ) カルボニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-4-イル) エチル) アミノ) プロパベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.03分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 552 (M+H)<sup>+</sup>。実施例 4 (448)

25 3- (N- ( (2- (2- ( (1-ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-4-イル) エチル) アミノ) プロパベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.23分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 558 (M+H)<sup>+</sup>。実施例 4 (449)

5 3- (N- ( (2- (2- ( (ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-4-イル) エチル) アミノ) プロパベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 2.72分;

10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 509 (M+H)<sup>+</sup>, 255。実施例 4 (450)

15 3- (N- ( (2- (2- ( (α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-4-イル) エチル) アミノ) プロパベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.14分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)<sup>+</sup>。実施例 4 (451)

20 3- (N- ( (2- (2- ( (ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-4-イル) エチル) アミノ) プロパベン酸

HPLC測定条件: A

25 HPLC保持時間: 3.07分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 508 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (4.5.2)

- 3- (N- ( (2- (2- (2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-4-イル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.16分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)<sup>+</sup>.

10 実施例 4 (4.5.3)

- 3- (N- ( (2- (2- (4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-4-イル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

- 15 HPLC保持時間: 3.20分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 542 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (4.5.4)

- 3- (N- ( (2- (2- (N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-4-イル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.22分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 536 (M+H)<sup>+</sup>.

- 25

実施例 4 (4.5.5)

- 3- (N- ( (2- (2- (N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-4-イル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

- 5 HPLC保持時間: 3.40分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 564 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (4.5.6)

- 3- (N- ( (2- (2- (4- (tert-ブチル) ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-4-イル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.38分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 564 (M+H)<sup>+</sup>.

- 15

実施例 4 (4.5.7)

- 3- (N- ( (2- (2- (1-フェニル-3-ヒドロキシプロピルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-4-イル) エチル) アミノ) プロパン酸

- 20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 2.98分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 552 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (4.5.8)

- 25 3- (N- ( (2- (2- (2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-4-イル) エチル) アミノ) プロパン酸

チル) アミノ) フロバベン

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.11 分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 526 (M+H)<sup>+</sup>.

5

実施例 4 (4.5.9)

3- (N- ( (2- (2- ( (2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ  
ニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-4-イル)  
ル) エチル) アミノ) フロバベン

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.14 分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 544 (M+H)<sup>+</sup>.

10

実施例 4 (4.6.0)

15 3- (N- ( (2- (2- ( (1R) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ  
チルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-  
(ピリジン-4-イル) エチル) アミノ) フロバベン

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.00 分:

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)<sup>+</sup>, 201.

実施例 4 (4.6.1)

25 3- (N- ( (2- (2- ( (2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-4-イル) エチ  
ル) アミノ) フロバベン

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.18 分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 542 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (4.6.2)

5 3- (N- ( (2- (2- ( (4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-4-イル) エ  
チル) アミノ) フロバベン

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.12 分:

10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 526 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (4.6.3)

15 3- (N- ( (2- (2- ( (3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-4-イル) エチ  
ル) アミノ) フロバベン

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.20 分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 542 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (4.6.4)

20 3- (N- ( (2- (2- ( (1S) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ  
チルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-  
(ピリジン-4-イル) エチル) アミノ) フロバベン

HPLC測定条件: A

25 HPLC保持時間: 2.98 分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (465)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (1R) -1- (4-メチルフェニル) エチルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-4-イル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.22分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 536 (M+H)<sup>+</sup>.

10 実施例 4 (466)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (1- (4-フルオロフェニル) エチルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-4-イル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

- 15 HPLC保持時間: 3.16分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 540 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (467)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (3S) -3-ピロキシメチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-4-イル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 2.96分:

- 25 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 564 (M+H)<sup>+</sup>, 282;

HPLC保持時間: 3.07分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 564 (M+H)<sup>+</sup>, 482, 282.

実施例 4 (468)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-4-イル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.18分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)<sup>+</sup>.

10

実施例 4 (469)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2-イル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-4-イル) エチル) アミノ) フロバノン酸

- 15 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 2.74分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H)<sup>+</sup>, 432, 269.

実施例 4 (470)

- 20 3- (N- ( (2- (2- ( (N- (2- (N, N-ジメチルアミノ) エチル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-4-イル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 2.92分:

- 25 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 579 (M+H)<sup>+</sup>, 290, 267.



実施例 4 (471)

3- (N- (2- (2- (1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-フェニルエチル) アミノ) プロパノ酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.97分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 547 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (472)

10 3- (N- (2- (2- (N-ベンジル-N- (2-ヒドロキシエチル) アミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-フェニルエチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.66分:

15 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (473)

3- (N- (2- (2- (1-ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-フェニルエチル) アミノ) プロパノ酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.00分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (474)

3- (N- (2- (2- (ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-フェニルエチル) アミノ) プロパノ酸

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-フェニルエチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.23分:

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 508 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (475)

3- (N- (2- (2- (α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-フェニルエチル) アミノ) プロパノ酸

10 ロバノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.88分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 521 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (476)

3- (N- (2- (2- (2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-フェニルエチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.88分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 521 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (477)

3- (N- (2- (2- (4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-フェニルエチル) アミノ) プロパノ酸

25 ロバノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.95分；

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 541 (M+H)<sup>+</sup>。

5 実施例 4 (478)

3-(N-(2-(2-(N-エチル-N-ベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-フェニルエチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

10 HPLC保持時間：3.91分；

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 535 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (479)

15 3-(N-(2-(2-(N-ブチル-N-ベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-フェニルエチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：4.10分；

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 563 (M+H)<sup>+</sup>。

20

実施例 4 (480)

3-(N-(2-(2-(4-(tert-ブチル)ベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-フェニルエチル)アミノ)プロパン酸

25 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：4.13分；

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 563 (M+H)<sup>+</sup>。

5 実施例 4 (481)

3-(N-(2-(2-(1-フェニル-3-ヒドロキシプロピルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-フェニルエチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.66分；

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>。

10

実施例 4 (482)

3-(N-(2-(2-(2,5-ジフルオロベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-フェニルエチル)アミノ)プロパン酸

15 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.86分；

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 543 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (483)

20 3-(N-(2-(2-(2-(1R)-1-フェニル-2-ヒドロキシエチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-フェニルエチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.64分；

25 MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 537 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (4.8.4)

3- (N- ( (2- (2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ  
 エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2-フエニルエチル) アミノ) フ  
 ロバペン酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.93分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 541 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (4.8.5)

10 3- (N- ( (2- (2- (3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ  
 エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2-フエニルエチル) アミノ) フ  
 ロバペン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.95分;

15 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 541 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (4.8.6)

3- (N- ( (2- (2- ( (1S) -1-フエニル-2-ヒドロキシエ  
 チルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2-  
 フエニルエチル) アミノ) フロバペン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.66分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H)<sup>+</sup>.

25 実施例 4 (4.8.7)

3- (N- ( (2- (2- ( (1R) -1- (4-メチルフエニル) エチ

ルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2-フ  
 エニルエチル) アミノ) フロバペン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.97分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (4.8.8)

3- (N- ( (2- (2- ( (1- (4-フルオロフエニル) エチルアミノ)  
 カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2-フエニルエチ  
 ル) アミノ) フロバペン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.91分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 539 (M+H)<sup>+</sup>.

15 実施例 4 (4.8.9)

3- (N- ( (2- (2- ( ( (3S) -3-ヒドロキシメチル-1, 2,  
 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル) フエニル) フ  
 エニル) カルボニル) -N- (2-フエニルエチル) アミノ) フロバペン酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.55分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 563 (M+H)<sup>+</sup>;

HPLC保持時間: 3.69分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 563 (M+H)<sup>+</sup>, 459.

25 実施例 4 (4.9.0)

3- (N- ( (2- (2- ( (3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-フェニルエチル) アミノ) フ  
ロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.89分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 521 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (4.9.1)

3-(N-(2-(2-(3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ  
ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-フェニルエチル) ア  
ミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.91分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 543 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 15 実施例 4 (4.9.2)

3-(N-(2-(2-(N-メチル-N-(6-メチルピリジン-2  
-イル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -  
N-(2-フェニルエチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.22分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 536 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (4.9.3)

3-(N-(2-(2-(N-(2-(N, N-ジメチルアミノ) エチ  
ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル)  
-N-(2-フェニルエチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.44分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 578 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 5 実施例 4 (4.9.4)

3-(N-(2-(2-(2-フェニルエチルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-フェニルエチル) アミ  
ノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

10 HPLC保持時間: 3.88分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 521 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (4.9.5)

3-(N-(2-(2-(2-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチ  
ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4  
-メトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.95分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)<sup>+</sup>.

20

#### 実施例 4 (4.9.6)

3-(N-(2-(2-(N-ベンジル-N-(2-ヒドロキシエチル)  
アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4  
-メトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

25

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.64分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (497)

3- (N- ( (2- (2- (2-トリルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.67分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 527 (M+H)<sup>+</sup>。

10

実施例 4 (498)

3- (N- ( (2- (2- (1-イソブチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.88分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 563 (M+H)<sup>+</sup>。

15

実施例 4 (499)

20 3- (N- ( (2- (2- (1-ナチルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.95分;

25 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 587 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (500)

3- (N- ( (2- (2- (ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.23分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (501)

10 3- (N- ( (2- (2- (ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.16分;

15 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (502)

20 3- (N- ( (2- (2- (1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.84分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 563 (M+H)<sup>+</sup>。

25 実施例 4 (503)

3- (N- ( (2- (2- (α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-メトキシフェニル) エ  
チル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.86分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (504)

3-(N-(2-(2-(ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フ  
エニル) カルボニル) -N-(2-(4-メトキシフェニル) エチル) アミ  
ノ) フロバノン酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.78分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H)<sup>+</sup>.

15 実施例 4 (505)

3-(N-(2-(2-(2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-メトキシフェニル) エ  
チル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.84分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (506)

3-(N-(2-(2-(4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-メトキシフェニル) エ  
チル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.91分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 571 (M+H)<sup>+</sup>.

5 実施例 4 (507)

3-(N-(2-(2-(N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ  
ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-メトキシフェニ  
ル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

10 HPLC保持時間: 3.89分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (508)

3-(N-(2-(2-(N-ブチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ  
ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-メトキシフェニ  
ル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.08分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)<sup>+</sup>.

20 実施例 4 (509)

3-(N-(2-(2-(4-(tert-ブチル) ベンジルアミノ) カルボニ  
ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-メトキシフェニ  
ル) エチル) アミノ) フロバノン酸

25 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.10分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (510)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (1-フェニル-3-ヒドロキシプロピル) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.62分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>。

10

実施例 4 (511)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (2-フルオロベンジル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.80分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (512)

- 20 3- (N- ( (2- (2- ( (2, 5-ジフルオロベンジル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.84分:

25 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 573 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (513)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (1R) -1-フェニル-2-ヒドロキシエチル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.62分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (514)

- 10 3- (N- ( (2- (2- ( (2-クロロベンジル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.88分:

15 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 571 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (515)

- 20 3- (N- ( (2- (2- ( (4-フルオロベンジル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.80分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)<sup>+</sup>。

25 実施例 4 (516)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (2, 6-ジフルオロベンジル) カルボニル) カルボニル) カルボニル) -N- (2- (4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

ニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-(4-メトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.78分:

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 573 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (517)

3-(N-(2-(2-(3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-(4-メトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.91分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 571 (M+H)<sup>+</sup>.

15 実施例 4 (518)

3-(N-(2-(2-(1S)-1-フエニル-2-ヒドロキシエチルアミノ) カルボニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-(4-メトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.62分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (519)

3-(N-(2-(2-(1R)-1-(4-メチルフエニル) エチルアミノ) カルボニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-(4-メトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.93分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)<sup>+</sup>.

5 実施例 4 (520)

3-(N-(2-(2-(1-(4-フルオロフエニル) エチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-(4-メトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

10 HPLC保持時間: 3.89分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 569 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (521)

3-(N-(2-(2-(2-チエニルメチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-(4-メトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.77分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 543 (M+H)<sup>+</sup>.

20

実施例 4 (522)

3-(N-(2-(2-(3S)-3-ヒドロキシメチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-(4-メトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

25

HPLC測定条件: A



HPLC保持時間：3.51分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)<sup>+</sup>；

HPLC保持時間：3.66分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)<sup>+</sup>, 489。

5

実施例4 (5.2.3)

3- (N- ( (2- (2- ( (3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (4-メトキシフエニル) エ  
チル) アミノ) フロバノン酸

10 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.86分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (5.2.4)

15 3- (N- ( (2- (2- ( (3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ  
ニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (4-メトキシフエ  
ニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.88分；

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 573 (M+H)<sup>+</sup>。実施例4 (5.2.5)

3- (N- ( (2- (2- ( (N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2  
-イル) メチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -  
N- (2- (4-メトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

25 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.20分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 566 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (5.2.6)

5 3- (N- ( (2- (2- ( (N- (2- (N, N-ジメチルアミノ) エチ  
ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル)  
-N- (2- (4-メトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.44分；

10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 608 (M+H)<sup>+</sup>。実施例4 (5.2.7)

3- (N- ( (2- (2- ( (2-フエニルエチルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (4-メトキシフエニル) エ  
チル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.86分；

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>。実施例4 (5.2.8)

3- (N- ( (2- (2- ( (1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチ  
ルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (4  
-アミノスルホニルフエニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件：A

25 HPLC保持時間：3.60分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 626 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (5.2.9)

- 3- (N- ( (2- (2- (N-ベンジル-N- (2-ヒドロキシエチル) フエニル) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (4-アミノスルホニルエチル) エチル) アミノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.33分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 630 (M+H)<sup>+</sup>.10 実施例 4 (5.3.0)

- 3- (N- ( (2- (2- (2-トリルメチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (4-アミノスルホニルエチル) エチル) アミノ酸

HPLC測定条件: A

- 15 HPLC保持時間: 3.34分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 576 (M+H)<sup>+</sup>, 248.実施例 4 (5.3.1)

- 3- (N- ( (2- (2- (1-インダノアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (4-アミノスルホニルエチル) エチル) アミノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.53分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 612 (M+H)<sup>+</sup>.25 実施例 4 (5.3.2)

- 3- (N- ( (2- (2- (1-ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (4-アミノスルホニルエチル) エチル) アミノ酸

HPLC測定条件: A

- 5 HPLC保持時間: 3.59分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 636 (M+H)<sup>+</sup>.実施例 4 (5.3.3)

- 3- (N- ( (2- (2- (ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (4-アミノスルホニルエチル) エチル) アミノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 2.96分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 587 (M+H)<sup>+</sup>.

- 15

実施例 4 (5.3.4)

- 3- (N- ( (2- (2- (ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (4-アミノスルホニルエチル) エチル) アミノ酸

- 20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 2.94分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 587 (M+H)<sup>+</sup>.実施例 4 (5.3.5)

- 25 3- (N- ( (2- (2- (1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2-

(4-アミノスルホニルフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.53分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 612 (M+H)<sup>+</sup>。

5

実施例 4 (5.3.6)

3- (N- ( (2- (2- (α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-アミノスルホニルフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.51分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 600 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (5.3.7)

15 3- (N- ( (2- (2- (ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-アミノスルホニルフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.45分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 586 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (5.3.8)

3- (N- ( (2- (2- (2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-アミノスルホニルフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

25 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.47分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 616 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (5.3.9)

5 3- (N- ( (2- (2- (2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-アミノスルホニルフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.49分;

10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 600 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (5.4.0)

15 3- (N- ( (2- (2- (3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-アミノスルホニルフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.44分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 616 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (5.4.1)

20 3- (N- ( (2- (2- (4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-アミノスルホニルフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

25 HPLC保持時間: 3.56分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 620 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (5.4.2)

3- (N- (2- (2- (4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-アミノスルホニル) フェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.40分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 616 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (5.4.3)

3- (N- (2- (2- (4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-アミノスルホニル) フェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.51分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 600 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (5.4.4)

3- (N- (2- (2- (N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-アミノスルホニル) フェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.49分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 600 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (5.4.5)

3- (N- (2- (2- (N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-アミノスルホニル) フェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.56分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 614 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (5.4.6)

10 3- (N- (2- (2- (N-アチル-N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-アミノスルホニル) フェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.75分;

15 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 642 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (5.4.7)

3- (N- (2- (2- (4- (tert-ブチル) ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-アミノスルホニル) フェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.73分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 642 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (5.4.8)

25 3- (N- (2- (2- (1-フェニル-3-ヒドロキシプロピルアミ

ノ) カルボニル フェニル フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-ア  
ミノスルホニルフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.29分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 630 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (5.4.9)

3-(N-(2-(2-(3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-アミノスルホニル  
フェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.45分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 604 (M+H)<sup>+</sup>。

15 実施例 4 (5.5.0)

3-(N-(2-(2-(3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-アミノスルホニル  
フェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.45分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 604 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (5.5.1)

3-(N-(2-(2-(2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ  
ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-アミノスルホ  
ニルフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.47分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 622 (M+H)<sup>+</sup>。

5 実施例 4 (5.5.2)

3-(N-(2-(2-(1R)-1-フェニル-2-ヒドロキシエ  
チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-  
(4-アミノスルホニルフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

10 HPLC保持時間: 3.27分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 616 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (5.5.3)

3-(N-(2-(2-(2-クロロベンジルアミノ) カルボニル)   
フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-アミノスルホニル  
フェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.53分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 620 (M+H)<sup>+</sup>。

20

実施例 4 (5.5.4)

3-(N-(2-(2-(4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-アミノスルホニル  
フェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

25 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.47分;

MASデータ (ESI, Pos., 20V) : 604 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (5.5.5)

3- (N- ( (2- (2- ( (7リルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-アミノスルホニルフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.25 分;

MASデータ (ESI, Pos., 20V) : 536 (M+H)<sup>+</sup>.

10

実施例 4 (5.5.6)

3- (N- ( (2- (2- ( (2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-アミノスルホニルフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.44 分;

MASデータ (ESI, Pos., 20V) : 622 (M+H)<sup>+</sup>.

15

実施例 4 (5.5.7)

20 3- (N- ( (2- (2- ( (3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-アミノスルホニルフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.55 分;

25 MASデータ (ESI, Pos., 20V) : 620 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (5.5.8)

3- (N- ( (2- (2- ( (1S) -1-フェニル-2-ヒドロキシエチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-アミノスルホニルフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.27 分;

MASデータ (ESI, Pos., 20V) : 616 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (5.5.9)

10 3- (N- ( (2- (2- ( (1R) -1- (4-メチルフェニル) エチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-アミノスルホニルフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.56 分;

15 MASデータ (ESI, Pos., 20V) : 614 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (5.6.0)

20 3- (N- ( (2- (2- ( (1- (4-フルオロフェニル) エチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-アミノスルホニルフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.53 分;

MASデータ (ESI, Pos., 20V) : 618 (M+H)<sup>+</sup>.

25 実施例 4 (5.6.1)

3- (N- ( (2- (2- ( (2-チエニルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-アミノスルホニルフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

エニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-(4-アミノスルホニルフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.40分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 592 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (5.6.2)

3-(N-(2-(2-(3,4-ジクロロベンゾイル)-2-アミノ-2-ヒドロキシメチル-1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-(4-アミノスルホニルフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.23分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 642 (M+H)<sup>+</sup>;

15 HPLC保持時間: 3.36分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 642 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (5.6.3)

3-(N-(2-(2-(3-メチルベンゾイル) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-(4-アミノスルホニルフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.53分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 600 (M+H)<sup>+</sup>。

25

#### 実施例 4 (5.6.4)

3-(N-(2-(2-(3,5-ジフルオロベンゾイル) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-(4-アミノスルホニルフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 3.51分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 622 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (5.6.5)

3-(N-(2-(2-(N-メチル-N-(6-メチルピリジン-2-イル) メチル) アミノ) カルボニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-(4-アミノスルホニルフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 2.96分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 615 (M+H)<sup>+</sup>, 361。

15

#### 実施例 4 (5.6.6)

3-(N-(2-(2-(N-(2-(N,N-ジメチル) アミノ) エチル) -N-ベンゾイル) カルボニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-(4-アミノスルホニルフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

20 酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.18分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 657 (M+H)<sup>+</sup>, 403。

25 実施例 4 (5.6.7)

3-(N-(2-(2-(2-(2-フェニルエチル) アミノ) カルボニル) フ

エニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(4-アミノスルホニルフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.49分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 600 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (568)

3-(N-(2-(2-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2, 4-ジクロロフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.21分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 615 (M+H)<sup>+</sup>。

15 実施例 4 (569)

3-(N-(2-(2-(N-ベンジル-N-(2-ヒドロキシエチル) アミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2, 4-ジクロロフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.88分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 619 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (570)

3-(N-(2-(2-(1-ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2, 4-ジクロロフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.21分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 625 (M+H)<sup>+</sup>。

5 実施例 4 (571)

3-(N-(2-(2-(ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2, 4-ジクロロフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

10 HPLC保持時間: 3.44分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 576 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (572)

3-(N-(2-(2-( $\alpha$ -メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2, 4-ジクロロフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.11分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 589 (M+H)<sup>+</sup>。

20

実施例 4 (573)

3-(N-(2-(2-(ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(2, 4-ジクロロフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

25 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.04分;



MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 575 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (574)

- 3- (N- ( (2- (2- (4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 4-ジクロロフエニル)  
エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.11分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 589 (M+H)<sup>+</sup>。

10

実施例 4 (575)

- 3- (N- ( (2- (2- (4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 4-ジクロロフエニル)  
エチル) アミノ) フロバノン酸

15

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.17分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 609 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (576)

- 20 3- (N- ( (2- ( (4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フエニ  
ル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 4-ジクロロフエニル) エ  
チル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.00分;

25

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 605 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (577)

- 3- (N- ( (2- (2- (N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ  
ル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 4-ジクロロフ  
エニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

5

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.17分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 603 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (578)

- 10 3- (N- ( (2- (2- (N-アチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ  
ル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 4-ジクロロフ  
エニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.34分;

15

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 631 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (579)

- 3- (N- ( (2- (2- (4- (tert-ブチル) ベンジルアミノ) カルボニ  
ル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 4-ジクロロフ  
エニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.35分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 631 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (580)

- 25 3- (N- ( (2- (2- (1-フエニル-3-ヒドロキシプロピルアミ  
ノ) カルボニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 4-ジクロロフ  
エニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

ノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N-(2, 4-ジクロロフエニル) エチル) テミノ) フロバベンソ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.88分:

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 619 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (5.8.1)

3- (N- ( (2- (2- ( (2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 4-ジクロロフエニル) エチル) テミノ) フロバベンソ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.08分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)<sup>+</sup>.

15 実施例 4 (5.8.2)

3- (N- ( (2- (2- ( (2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 4-ジクロロフエニル) エチル) テミノ) フロバベンソ酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 4.10分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 611 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (5.8.3)

3- (N- ( (2- (2- ( (1R) -1-フエニル-2-ヒドロキシエチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 4-ジクロロフエニル) エチル) テミノ) フロバベンソ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.88分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 605 (M+H)<sup>+</sup>.

5 実施例 4 (5.8.4)

3- (N- ( (2- (2- ( (2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 4-ジクロロフエニル) エチル) テミノ) フロバベンソ酸

HPLC測定条件: A

10 HPLC保持時間: 4.15分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 609 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (5.8.5)

3- (N- ( (2- (2- ( (4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 4-ジクロロフエニル) エチル) テミノ) フロバベンソ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.06分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)<sup>+</sup>.

20

実施例 4 (5.8.6)

3- (N- ( (2- (2- ( (3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 4-ジクロロフエニル) エチル) テミノ) フロバベンソ酸

25 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.21分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 609 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (5.8.7)

- 3 - (N - ( (2 - ( (1S) - 1 - フェニル - 2 - ヒドロキシエ  
チルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) - N - (2 -  
(2, 4 - ジクロロフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.88 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 605 (M+H)<sup>+</sup>。

10

実施例 4 (5.8.8)

- 3 - (N - ( (2 - (2 - ( (1R) - 1 - (4 - メチルフェニル) エチ  
ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) - N - (2 - (2,  
4 - ジクロロフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

15 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.22 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 603 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (5.8.9)

- 20 3 - (N - ( (2 - (2 - ( (1 - (4 - フルオロフェニル) エチルアミノ)  
カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) - N - (2 - (2, 4 - ジ  
クロロフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.15 分;

25 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (5.9.0)

- 3 - (N - ( (2 - (2 - ( (3S) - 3 - ヒドロキシメチル - 1, 2,  
3, 4 - テトラヒドロイソキノリン - 2 - イル) カルボニル) フェニル) フ  
ェニル) カルボニル) - N - (2 - (2, 4 - ジクロロフェニル) エチル)  
アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.73 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 631 (M+H)<sup>+</sup>;

HPLC保持時間: 3.93 分;

10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 631 (M+H)<sup>+</sup>, 527。

実施例 4 (5.9.1)

- 3 - (N - ( (2 - (2 - ( (3 - メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ  
ェニル) フェニル) カルボニル) - N - (2 - (2, 4 - ジクロロフェニル)  
エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.15 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 589 (M+H)<sup>+</sup>。

20 実施例 4 (5.9.2)

- 3 - (N - ( (2 - (2 - ( (3, 5 - ジフルオロベンジルアミノ) カルボ  
ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) - N - (2 - (2, 4 - ジクロ  
ロフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

25 HPLC保持時間: 4.13 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 611 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (5.9.3)

- 3- (N- ( (2- (2- (N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2-  
-イル) メチルアミノ) カルボニル) アミノ) アミノ) カルボニル) -  
N- (2- (2, 4-ジクロロアミノ) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.40 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 604 (M+H)<sup>+</sup>。

10 実施例 4 (5.9.4)

- 3- (N- ( (2- (2- (N- (N- (N- ジメチルアミノ) エチ  
ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) アミノ) カルボニル) カルボニル)  
-N- (2- (2, 4-ジクロロアミノ) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

## 15 HPLC保持時間: 3.62 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 646 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (5.9.5)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (2-アミノエチルアミノ) カルボニル) ア  
ミノ) アミノ) カルボニル) -N- (2- (2, 4-ジクロロアミノ)  
エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.13 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 589 (M+H)<sup>+</sup>。

25 実施例 4 (5.9.6)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチ  
ルアミノ) カルボニル) アミノ) アミノ) カルボニル) -N- (2- (4  
-エトキシアミノ) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

## 5 HPLC保持時間: 4.01 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 591 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (5.9.7)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (N-ベンジル-N- (2-ヒドロキシエチル)  
アミノ) カルボニル) アミノ) アミノ) カルボニル) -N- (2- (4  
-エトキシアミノ) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.71 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)<sup>+</sup>。

## 15

実施例 4 (5.9.8)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (1-ナフチルメチルアミノ) カルボニル) ア  
ミノ) アミノ) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシアミノ) エ  
チル) アミノ) プロパノ酸

## 20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.06 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 601 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (5.9.9)

- 25 3- (N- ( (2- (2- ( (ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニ  
ル) アミノ) アミノ) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシアミノ)

ル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.33分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 552 (M+H)<sup>+</sup>.

5

実施例 4 (6.0.0)

3- (N- ( (2- (2- ( (ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニル) アミノ) アミノ) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシアミノ) エチル) アミノ) プロパン酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.35分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 552 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (6.0.1)

15 3- (N- ( (2- (2- ( (2-アミノエチルアミノ) カルボニル) アミノ) アミノ) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.80分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 507 (M+H)<sup>+</sup>.

20

実施例 4 (6.0.2)

3- (N- ( (2- (2- ( (α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) アミノ) アミノ) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシアミノ) エチル) アミノ) プロパン酸

25 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.95分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (6.0.3)

5 3- (N- ( (2- (2- ( (ベンジルアミノ) カルボニル) アミノ) アミノ) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシアミノ) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.89分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>.

10

実施例 4 (6.0.4)

3- (N- ( (2- (2- ( (2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) アミノ) アミノ) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシアミノ) エチル) アミノ) プロパン酸

15 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.97分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (6.0.5)

20 3- (N- ( (2- (2- ( (4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) アミノ) アミノ) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシアミノ) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.02分;

25 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (606)

3- (N- (2- (4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

5

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>。10 実施例 4 (607)

3- (N- (2- (2- (N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

15 HPLC保持時間: 3.99分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 579 (M+H)<sup>+</sup>。実施例 4 (608)

3- (N- (2- (2- (N-アチル-N-ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.15分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H)<sup>+</sup>。

25

実施例 4 (609)

3- (N- (2- (2- (4- (tert-アチル) ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 4.19分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H)<sup>+</sup>。実施例 4 (610)

3- (N- (2- (2- (1-フエニル-3-ヒドロキシプロピルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.71分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)<sup>+</sup>。

15

実施例 4 (611)

3- (N- (2- (2- (2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.95分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 587 (M+H)<sup>+</sup>。実施例 4 (612)

25 3- (N- (2- (2- (1R) -1-フエニル-2-ヒドロキシエチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2-

(4-エトキシフェニル) エチル) テミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.73 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>。

5

実施例 4 (6.1.3)

3- (N- ( (2- (2- ( (3-クロロベンジル) テミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフェニル) エチル) テミノ) プロパノ酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.99 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (6.1.4)

15 3- (N- ( (2- (2- ( (3-クロロベンジル) テミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフェニル) エチル) テミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.00 分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (6.1.5)

3- (N- ( (2- (2- ( (1S) -1-フェニル-2-ヒドロキシエチル) テミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフェニル) エチル) テミノ) プロパノ酸

25 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.71 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (6.1.6)

5 3- (N- ( (2- (2- ( (1R) -1- (4-メチルフェニル) エチル) テミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフェニル) エチル) テミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.04 分;

10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 579 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (6.1.7)

3- (N- ( (2- (2- ( (1- (4-フルオロフェニル) エチル) テミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフェニル) エチル) テミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.99 分;

15 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 583 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (6.1.8)

20 3- (N- ( (2- (2- ( (3S) -3-ヒドロキシエチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフェニル) エチル) テミノ) プロパノ酸

25 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.60 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H)<sup>+</sup> ;

HPLC保持時間 : 3.78 分 ;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H)<sup>+</sup>, 503.

5 実施例 4 (6.1.9)

3- (N- ( (2- (2- (3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフエニル) エ  
チル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件 : A

10 HPLC保持時間 : 3.97 分 ;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (6.2.0)

15 3- (N- ( (2- (2- (3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ  
ニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフ  
エニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件 : A

HPLC保持時間 : 3.96 分 ;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 587 (M+H)<sup>+</sup>.

20

実施例 4 (6.2.1)

3- (N- ( (2- (2- (N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2  
-イル) メチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -  
N- (2- (4-エトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

25 HPLC測定条件 : A

HPLC保持時間 : 3.29 分 ;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 580 (M+H)<sup>+</sup>.

5 実施例 4 (6.2.2)

3- (N- ( (2- (2- (N- (2- (N, N-ジメチルアミノ) エチ  
ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル)  
-N- (2- (4-エトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件 : A

HPLC保持時間 : 3.51 分 ;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 622 (M+H)<sup>+</sup>.

10

実施例 4 (6.2.3)

3- (N- ( (2- (2- (2-フエニルエチルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフエニル) エ  
チル) アミノ) フロバベン酸

15 HPLC測定条件 : A

HPLC保持時間 : 3.97 分 ;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (6.2.4)

20 3- (N- ( (2- (2- (1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチ  
ルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (4-フ  
ルオロベンジル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件 : A

HPLC保持時間 : 3.95 分 ;

25 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>.



実施例 4 (6.2.5)

3- (N- ( (2- (2- (N-ベンジル-N- (2-ヒドロキシエチル) アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-フルオロベンジル) アミノ) フロバノン酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.64分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (6.2.6)

10 3- (N- ( (2- (2- (1-イソタンアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-フルオロベンジル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.88分;

15 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (6.2.7)

3- (N- ( (2- (2- (1-ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-フルオロベンジル) アミノ)

20 フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.95分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 561 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (6.2.8)

3- (N- ( (2- (2- (ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-フルオロベンジル) アミノ) フロバノン酸

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-フルオロベンジル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.20分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 512 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (6.2.9)

3- (N- ( (2- (2- (ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-フルオロベンジル) アミノ) フロバノン酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.14分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 512 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (6.3.0)

15 3- (N- ( (2- (2- (1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-フルオロベンジル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (6.3.1)

3- (N- ( (2- (2- (α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-フルオロベンジル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.86分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 525 (M+H)<sup>+</sup>。

5 実施例4 (6.3.2)

3- (N- ( (2- (2- (ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-フルオロベンジル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.78分；

10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 511 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (6.3.3)

3- (N- ( (2- (2- (2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-フルオロベンジル) アミノ)

15 プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.78分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 541 (M+H)<sup>+</sup>。

20 実施例4 (6.3.4)

3- (N- ( (2- (2- (2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-フルオロベンジル) アミノ)

プロパノ酸

HPLC測定条件：A

25 HPLC保持時間：3.86分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 525 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (6.3.5)

3- (N- ( (2- (2- (3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-フルオロベンジル) アミノ)

5 プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.77分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 541 (M+H)<sup>+</sup>。

10 実施例4 (6.3.6)

3- (N- ( (2- (2- (4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-フルオロベンジル) アミノ)

プロパノ酸

HPLC測定条件：A

15 HPLC保持時間：3.91分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 545 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (6.3.7)

20 3- (N- ( (2- (2- (4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (4-フルオロベンジル) アミノ)

プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.73分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 541 (M+H)<sup>+</sup>。

25

実施例4 (6.3.8)

3- (N- (2- (2- (4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (4-フルオロベンジル) アミノ)  
プロパノ酸

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 525 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (6.3.9)

3- (N- (2- (2- (N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ  
ル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (4-フルオロベンジル) ア  
ミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.84分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 525 (M+H)<sup>+</sup>.

15

実施例 4 (6.4.0)

3- (N- (2- (2- (N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ  
ル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (4-フルオロベンジル) ア  
ミノ) プロパノ酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.91分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 539 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (6.4.1)

25 3- (N- (2- (2- (N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ  
ル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (4-フルオロベンジル) ア

ミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.06分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)<sup>+</sup>.

5

実施例 4 (6.4.2)

3- (N- (2- (2- (4- (tert-ブチル) ベンジルアミノ) カルボニ  
ル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (4-フルオロベンジル) ア  
ミノ) プロパノ酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.10分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (6.4.3)

15 3- (N- (2- (2- (1-フェニル-3-ヒドロキシプロピルアミ  
ノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (4-フルオロ  
ベンジル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.62分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (6.4.4)

25 3- (N- (2- (2- (2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)  
フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (4-フルオロベンジル) アミノ)  
プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間：3.80分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 529 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (6.4.5)

5 3-(N-(2-(2-(3-フルオロベンジルアミノ)カルボニル)

フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(4-フルオロベンジル)アミノ)

プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.82分；

10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 529 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (6.4.6)

3-(N-(2-(2-(2,5-ジフルオロベンジルアミノ)カルボニル)

フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(4-フルオロベンジル)

15 アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.82分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 547 (M+H)<sup>+</sup>。

20 実施例 4 (6.4.7)

3-(N-(2-(2-(2-(1R)-1-フェニル-2-ヒドロキシエチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(4-フルオロベンジル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

25 HPLC保持時間：3.60分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 541 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (6.4.8)

3-(N-(2-(2-(2-クロロベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(4-フルオロベンジル)アミノ)

5 プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.89分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 545 (M+H)<sup>+</sup>。

10 実施例 4 (6.4.9)

3-(N-(2-(2-(4-フルオロベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(4-フルオロベンジル)アミノ)

プロパノ酸

HPLC測定条件：A

15 HPLC保持時間：3.78分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 529 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (6.5.0)

20 3-(N-(2-(2-(2-(アリルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(4-フルオロベンジル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.62分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 461 (M+H)<sup>+</sup>。

25 実施例 4 (6.5.1)

3-(N-(2-(2-(2-(2,6-ジフルオロベンジルアミノ)カルボ

ニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N-(4-フルオロベンジル)

アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.78分:

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 547 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (6.5.2)

3-(N-(2-(2-(3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N-(4-フルオロベンジル) アミノ)

10 フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.91分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 545 (M+H)<sup>+</sup>.

15 実施例 4 (6.5.3)

3-(N-(2-(2-(1S)-1-フエニル-2-ヒドロキシエ  
チルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N-(4-  
フルオロベンジル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.60分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 541 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (6.5.4)

25 3-(N-(2-(2-(1R)-1-(4-メチルフエニル) エチ  
ルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N-(4-フ  
ルオロベンジル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.95分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 539 (M+H)<sup>+</sup>.

5 実施例 4 (6.5.5)

3-(N-(2-(2-(1-(4-フルオロフエニル) エチルアミノ)  
カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N-(4-フルオロベン  
ジル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

10 HPLC保持時間: 3.88分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 543 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (6.5.6)

15 3-(N-(2-(2-(2-チエニルメチルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N-(4-フルオロベンジル) アミノ)  
フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.73分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 517 (M+H)<sup>+</sup>.

20 実施例 4 (6.5.7)

3-(N-(2-(2-(3S)-3-ヒドロキシメチル-1, 2,  
3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル) フエニル) フ  
エニル) カルボニル) -N-(4-フルオロベンジル) アミノ) フロバベン酸

25 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.49分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)<sup>+</sup> ;

HPLC保持時間 : 3.66 分 ;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 5 実施例 4 (6.5.8)

3- (N- ( (2- (2- ( (3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (4-フルオロベンジル) アミノ)  
プロパノ酸

HPLC測定条件 : A

10 HPLC保持時間 : 3.86 分 ;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 525 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (6.5.9)

3- (N- ( (2- (2- ( (3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ  
ニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (4-フルオロベンジル)  
アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件 : A

HPLC保持時間 : 3.86 分 ;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 547 (M+H)<sup>+</sup>。

20

#### 実施例 4 (6.6.0)

3- (N- ( (2- (2- ( (N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2  
-イル) メチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -  
N- (4-フルオロベンジル) アミノ) プロパノ酸

25 HPLC測定条件 : A

HPLC保持時間 : 3.18 分 ;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 540 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (6.6.1)

3- (N- ( (2- (2- ( (N- (2- (N, N-ジメチルアミノ) エチ  
ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル)  
-N- (4-フルオロベンジル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件 : A

HPLC保持時間 : 3.40 分 ;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 582 (M+H)<sup>+</sup>。

10

#### 実施例 4 (6.6.2)

3- (N- ( (2- (2- ( (2-フェニルエチルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (4-フルオロベンジル) アミノ)  
プロパノ酸

15 HPLC測定条件 : A

HPLC保持時間 : 3.84 分 ;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 525 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (6.6.3)

20 3- (N- ( (2- (2- ( (1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチ  
ルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2  
-メチルフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件 : A

HPLC保持時間 : 4.06 分 ;

25 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 561 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (6 6 4)

3- (N- ( (2- (2- (N-ベンジル-N- (2-ヒドロキシエチル) アミノ) カルボニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.75 分:

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 565 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (6 6 5)

10 3- (N- ( (2- (2- (1-イソタンアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.01 分:

15 MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 547 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (6 6 6)

3- (N- ( (2- (2- (1-ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.06 分:

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 571 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (6 6 7)

3- (N- ( (2- (2- (ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

ル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.29 分:

5 MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 522 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (6 6 8)

10 3- (N- ( (2- (2- (ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.25 分:

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 522 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (6 6 9)

15 3- (N- ( (2- (2- (1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン-2-イル) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.97 分:

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 547 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (6 7 0)

25 3- (N- ( (2- (2- (α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.99分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)<sup>+</sup>。

5 実施例4 (6.7.1)

3- (N- (2- (2- (ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フ  
エニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフエニル) エチル) アミノ  
プロパン酸

HPLC測定条件：A

10 HPLC保持時間：3.91分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 521 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (6.7.2)

15 3- (N- (2- (2- (2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフエニル) エ  
チル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.91分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>。

20

実施例4 (6.7.3)

3- (N- (2- (2- (2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフエニル) エチ  
ル) アミノ) プロパン酸

25 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.99分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)<sup>+</sup>。

5 実施例4 (6.7.4)

3- (N- (2- (2- (3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)  
フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフエニル) エ  
チル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.89分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>。

10

実施例4 (6.7.5)

3- (N- (2- (2- (4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフエニル) エチ  
ル) アミノ) プロパン酸

15 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：4.02分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (6.7.6)

20 3- (N- (2- (2- (4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)  
フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフエニル) エ  
チル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.88分；

25 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>。



実施例 4 (677)

3- (N- (2- (2- (4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.99分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (678)

10 3- (N- (2- (2- (N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.93分;

15 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (679)

3- (N- (2- (2- (N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.02分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (680)

3- (N- (2- (2- (N-アチル-N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.21分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (681)

10 3- (N- (2- (2- (4- (tert-ブチル) ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.22分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (682)

15 3- (N- (2- (2- (1-フェニル-3-ヒドロキシプロピルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.73分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (683)

25 3- (N- (2- (2- (2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.91分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 539 (M+H)<sup>+</sup>。

5 実施例4 (684)

3-(N-(2-(2-(3-フルオロベンジルアミノ)カルボニル)

フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(2-メチルフェニル)エチル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

10 HPLC保持時間：3.95分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 539 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (685)

3-(N-(2-(2-(2,5-ジフルオロベンジルアミノ)カルボ

ニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(2-メチルフェニル)エチル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.93分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)<sup>+</sup>。

20

実施例4 (686)

3-(N-(2-(2-(2-(1R)-1-フェニル-2-ヒドロキシエチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-

(2-メチルフェニル)エチル)アミノ)プロパノ酸

25 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.73分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>。

5 実施例4 (687)

3-(N-(2-(2-(2-(2-クロロベンジルアミノ)カルボニル)フ

エニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(2-メチルフェニル)エチル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：4.00分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)<sup>+</sup>。

10

実施例4 (688)

3-(N-(2-(2-(2-(4-フルオロベンジルアミノ)カルボニル)

フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(2-メチルフェニル)エチル)アミノ)プロパノ酸

15 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.91分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 539 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (689)

20 3-(N-(2-(2-(2-(アリルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(2-メチルフェニル)エチル)アミノ)

プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.73分；

25 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 471 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (690)

3- (N- ( (2- (2- ( (2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフェニル) エチル) アミノ) フロバベンソ酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.88分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (691)

10 3- (N- ( (2- (2- ( (3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフェニル) エチル) アミノ) フロバベンソ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.02分;

15 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (692)

3- (N- ( (2- (2- ( ( (1S) -1-フェニル-2-ヒドロキシエチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフェニル) エチル) アミノ) フロバベンソ酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.73分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (693)

3- (N- ( (2- (2- ( ( (1R) -1- (4-メチルフェニル) エチ

ルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフェニル) エチル) アミノ) フロバベンソ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.06分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (694)

10 3- (N- ( (2- (2- ( (1- (4-フルオロフェニル) エチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフェニル) エチル) アミノ) フロバベンソ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.02分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 553 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (695)

15 3- (N- ( (2- (2- ( (2-チエニルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフェニル) エチル) アミノ) フロバベンソ酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.89分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 527 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (696)

25 3- (N- ( (2- (2- ( ( (3S) -3-ヒドロキシメチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフェニル) エチル) アミノ)

## プロパベン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.60分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)<sup>+</sup>；

5 HPLC保持時間：3.77分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)<sup>+</sup>。実施例 4 (697)

10 3- (N- ( (2- (2- (3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフエニル) エチ  
ル) アミノ) プロパベン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.96分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)<sup>+</sup>。

15

実施例 4 (698)

3- (N- ( (2- (2- (3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ  
ニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフエニ  
ル) エチル) アミノ) プロパベン酸

20 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.99分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)<sup>+</sup>。実施例 4 (699)

25 3- (N- ( (2- (2- (N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2  
-イル) メチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -

N- (2- (2-メチルフエニル) エチル) アミノ) プロパベン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.27分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 550 (M+H)<sup>+</sup>。

5

実施例 4 (700)

3- (N- ( (2- (2- (N- (N- ジメチルアミノ) エチ  
ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) カルボニル)  
-N- (2- (2-メチルフエニル) エチル) アミノ) プロパベン酸

10 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.51分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 592 (M+H)<sup>+</sup>。実施例 4 (701)

15 3- (N- ( (2- (2- (2-フエニルエチルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2-メチルフエニル) エチ  
ル) アミノ) プロパベン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.97分；

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)<sup>+</sup>。実施例 4 (702)

3- (N- ( (2- (2- (1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチ  
ルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2,  
5-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパベン酸

25 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間 : 3.99 分 ;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (703)

5 3- (N- ( (2- (2- (N-ベンジル-N- (2-ヒドロキシエチル)

アミノ) カルボニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2,

5-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) フロロベン

酸  
HPLC測定条件 : A

HPLC保持時間 : 3.66 分 ;

10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 611 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (704)

3- (N- ( (2- (2- (2-トリルメチルアミノ) カルボニル) フエ

ニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 5-ジメトキシフエニル)

15 エチル) アミノ) フロロベン

酸  
HPLC測定条件 : A

HPLC保持時間 : 3.73 分 ;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)<sup>+</sup>.

20 実施例 4 (705)

3- (N- ( (2- (2- (1-4-シタニアミノ) カルボニル) フエニル)

フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 5-ジメトキシフエニル) エチ

ル) アミノ) フロロベン

酸  
HPLC測定条件 : A

25 HPLC保持時間 : 3.93 分 ;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (706)

3- (N- ( (2- (2- (1-ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フ

エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 5-ジメトキシフエニ

5 ル) エチル) アミノ) フロロベン

酸  
HPLC測定条件 : A

HPLC保持時間 : 4.00 分 ;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 617 (M+H)<sup>+</sup>.

10 実施例 4 (707)

3- (N- ( (2- (2- (ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニ

ル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 5-ジメトキシ

フエニル) エチル) アミノ) フロロベン

酸  
HPLC測定条件 : A

15 HPLC保持時間 : 3.27 分 ;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 568 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (708)

3- (N- ( (2- (2- (ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニ

ル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 5-ジメトキシ

20 フエニル) エチル) アミノ) フロロベン

酸  
HPLC測定条件 : A

HPLC保持時間 : 3.20 分 ;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 568 (M+H)<sup>+</sup>.

25 実施例 4 (709)

3- (N- ( (2- (2- ( (1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン  
-2-イル) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2-  
(2, 5-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (7.1.0)

10 3- (N- ( (2- (2- ( (α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 5-ジメトキシフエ  
ニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.89分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>.

15

#### 実施例 4 (7.1.1)

3- (N- ( (2- (2- ( (ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フ  
エニル) カルボニル) -N- (2- (2, 5-ジメトキシフエニル) エチル)  
アミノ) プロパン酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.82分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (7.1.2)

25 3- (N- ( (2- (2- ( (2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)  
フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 5-ジメトキシフエ

ニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.84分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 597 (M+H)<sup>+</sup>.

5

#### 実施例 4 (7.1.3)

3- (N- ( (2- (2- ( (2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 5-ジメトキシフエ  
ニル) エチル) アミノ) プロパン酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.89分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (7.1.4)

15 3- (N- ( (2- (2- ( (3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)  
フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 5-ジメトキシフエ  
ニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.82分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 597 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (7.1.5)

25 3- (N- ( (2- (2- ( (4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 5-ジメトキシフエニ  
ル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間：3.97分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 601 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (716)

5 3-(N-(2-(2-(4-メトキシベンジルアミノ)カルボニル)

フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(2, 5-ジメトキシフェ

ニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.80分；

10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 597 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (717)

3-(N-(2-(2-(4-メチルベンジルアミノ)カルボニル)フェ

ニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(2, 5-ジメトキシフェニ

15 ル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.91分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>。

20 実施例4 (718)

3-(N-(2-(2-(N-メチル-N-ベンジルアミノ)カルボニ

ル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(2, 5-ジメトキシ

フェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

25 HPLC保持時間：3.84分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (719)

3-(N-(2-(2-(N-イソプロピル-N-ベンジルアミノ)カル

ボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(2, 5-ジメ

5 トキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.97分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 609 (M+H)<sup>+</sup>。

10 実施例4 (720)

3-(N-(2-(2-(N-エチル-N-ベンジルアミノ)カルボニ

ル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(2, 5-ジメトキシ

フェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

15 HPLC保持時間：3.91分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (721)

3-(N-(2-(2-(N-ブチル-N-ベンジルアミノ)カルボニ

20 ル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(2, 5-ジメトキシ

フェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：4.11分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 623 (M+H)<sup>+</sup>。

25 実施例4 (722)

3- (N- ( (2- (2- ( (4- (tert-ブチル) ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 5-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 4.13分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 623 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (723)

3- (N- ( (2- (2- ( (1-フエニル-3-ヒドロキシフロビルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 5-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.64分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 611 (M+H)<sup>+</sup>.

15

実施例 4 (724)

3- (N- ( (2- (2- ( (2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 5-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.84分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (725)

25 3- (N- ( (2- (2- ( (3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 5-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

ニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.84分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H)<sup>+</sup>.

5

実施例 4 (726)

3- (N- ( (2- (2- ( (2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 5-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.88分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 603 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (727)

15 3- (N- ( (2- (2- ( ( (1R) -1-フエニル-2-ヒドロキシエチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 5-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.66分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 597 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (728)

25 3- (N- ( (2- (2- ( (2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 5-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A



HPLC保持時間：3.93分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 601 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (7.2.9)

- 5 3-(N-(2-(2-(4-フルオロベンジルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(2, 5-ジメトキシフエニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.84分；

- 10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (7.3.0)

- 3-(N-(2-(2-(2-トリルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(2, 5-ジメトキシフエニル)エチル)

- 15 アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.66分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 517 (M+H)<sup>+</sup>。

- 20 実施例 4 (7.3.1)

- 3-(N-(2-(2-(2, 6-ジフルオロベンジルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(2, 5-ジメトキシフエニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

- 25 HPLC保持時間：3.80分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 603 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (7.3.2)

- 5 3-(N-(2-(2-(3-クロロベンジルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(2, 5-ジメトキシフエニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.95分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 601 (M+H)<sup>+</sup>。

- 10 実施例 4 (7.3.3)

- 3-(N-(2-(2-(2-(1S)-1-フエニル-2-ヒドロキシエチルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(2, 5-ジメトキシフエニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

- 15 HPLC保持時間：3.66分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 597 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (7.3.4)

- 20 3-(N-(2-(2-(2-(1R)-1-(4-メチルフエニル)エチルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(2, 5-ジメトキシフエニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.97分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)<sup>+</sup>。

- 25

実施例 4 (7.3.5)

3- (N- ( (2- (2- (1- (4-フルオロフェニル) エチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 5-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバベンズ酸

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 3.93分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 599 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (736)

10 3- (N- ( (2- (2- (2-チフェニルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 5-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバベンズ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.80分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 573 (M+H)<sup>+</sup>。

15

#### 実施例 4 (737)

3- (N- ( (2- (2- ( (3S) -3-ヒドロキシメチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 5-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバベンズ酸

20

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.55分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 623 (M+H)<sup>+</sup>;

HPLC保持時間: 3.71分;

25 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 623 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (738)

3- (N- ( (2- (2- (3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 5-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバベンズ酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.89分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (739)

10 3- (N- ( (2- (2- ( (3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 5-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバベンズ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.91分;

15 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 603 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (740)

3- (N- ( (2- (2- ( (N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2-イル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 5-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバベンズ酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.25分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 596 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (741)

25 3- (N- ( (2- (2- ( (N- (2- (N, N-ジメチルアミノ) エチ

ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル)  
-N- (2- (2, 5-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.47分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 638 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (7.4.2)

3- (N- (2- (2- (2-フエニルエチルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2, 5-ジメトキシフエニ  
ル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.89分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>。

15 実施例 4 (7.4.3)

3- (N- (2- (2- (1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチ  
ルアミノ) カルボニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3  
-エトキシ-4-メトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.91分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 621 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (7.4.4)

3- (N- (2- (2- (N-ベンジル-N- (2-ヒドロキシエチル)  
アミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3  
-エトキシ-4-メトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.60分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 625 (M+H)<sup>+</sup>。

5 実施例 4 (7.4.5)

3- (N- (2- (2- (2-フリルメチルアミノ) カルボニル) フエ  
ニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシ-4-メトキシ  
フエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

10 HPLC保持時間: 3.63分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 571 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (7.4.6)

3- (N- (2- (2- (1-インドラアミノ) カルボニル) フエニル)  
フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシ-4-メトキシフエニ  
ル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H)<sup>+</sup>。

20

実施例 4 (7.4.7)

3- (N- (2- (2- (1-ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシ-4-メトキ  
シフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

25 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.91分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 631 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (748)

3- (N- ( (2- (2- ( (ヒリジノ-2-イルメチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシ-4-メトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.20分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 582 (M+H)<sup>+</sup>。

10

実施例 4 (749)

3- (N- ( (2- (2- ( (ヒリジノ-3-イルメチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシ-4-メトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.14分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 582 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (750)

20 3- (N- ( (2- (2- ( (1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシ-4-メトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.80分;

25 MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 607 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (751)

3- (N- ( (2- (2- ( (α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシ-4-メトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.80分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 595 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (752)

10 3- (N- ( (2- (2- ( (ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシ-4-メトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.75分;

15 MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (753)

20 3- (N- ( (2- (2- ( (2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシ-4-メトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.75分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 611 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (754)

25 3- (N- ( (2- (2- ( (2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ

エニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシ-4-メトキシ  
フェニル) エチル) アミノ) プロパノール

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.82分:

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (755)

3- (N- ( (2- (2- ( (3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシ-4-メト

10 キシフェニル) エチル) アミノ) プロパノール

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.73分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 611 (M+H)<sup>+</sup>。

15 実施例 4 (756)

3- (N- ( (2- (2- ( (4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フェ  
ニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシ-4-メトキ  
シフェニル) エチル) アミノ) プロパノール

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.88分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 615 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (757)

3- (N- ( (2- (2- ( (4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシ-4-メト  
キシフェニル) エチル) アミノ) プロパノール

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.71分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 611 (M+H)<sup>+</sup>。

5 実施例 4 (758)

3- (N- ( (2- (2- ( (4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェ  
ニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシ-4-メトキ  
シフェニル) エチル) アミノ) プロパノール

HPLC測定条件: A

10 HPLC保持時間: 3.82分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (759)

3- (N- ( (2- (2- ( (N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ  
ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシ-4-  
メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノール

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.77分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)<sup>+</sup>。

20

実施例 4 (760)

3- (N- ( (2- (2- ( (N-イソプロピル-N-ベンジルアミノ) カ  
ルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシ  
-4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノール

25 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.91分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 623 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (7.6.1)

- 3- (N- ( (2- (2- (N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシ-4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 609 (M+H)<sup>+</sup>。

10

実施例 4 (7.6.2)

- 3- (N- ( (2- (2- (N-アチル-N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシ-4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

15 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.06分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 637 (M+H)<sup>+</sup>, 388。

実施例 4 (7.6.3)

- 20 3- (N- ( (2- (2- (4- (tert-ブチル) ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシ-4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.06分;

- 25 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 637 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (7.6.4)

- 3- (N- ( (2- (2- (1-フェニル-3-ヒドロキシプロピルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシ-4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.56分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 625 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (7.6.5)

- 10 3- (N- ( (2- (2- (2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシ-4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.75分;

- 15 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 599 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (7.6.6)

- 20 3- (N- ( (2- (2- (3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシ-4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.78分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 599 (M+H)<sup>+</sup>。

25 実施例 4 (7.6.7)

- 3- (N- ( (2- (2- (2- (5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシ-4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.80分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 617 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (768)

3-(N-(2-(2-(1R)-1-フェニル-2-ヒドロキシエチルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシ-4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.58分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 611 (M+H)<sup>+</sup>.

15 実施例 4 (769)

3-(N-(2-(2-(2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシ-4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 615 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (770)

3-(N-(2-(2-(4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシ-4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.77分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 599 (M+H)<sup>+</sup>.

5 実施例 4 (771)

3-(N-(2-(2-(アリルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシ-4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

10 HPLC保持時間: 3.58分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 531 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (772)

3-(N-(2-(2-(2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシ-4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.75分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 617 (M+H)<sup>+</sup>.

20

実施例 4 (773)

3-(N-(2-(2-(3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシ-4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

25 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.88分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 615 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (774)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (1S) -1-フェニル-2-ヒドロキシエチルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシ-4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.58分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 611 (M+H)<sup>+</sup>.

10

実施例 4 (775)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (1R) -1- (4-メチルフェニル) エチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシ-4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.91分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 609 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (776)

- 20 3- (N- ( (2- (2- ( (1- (4-フルオロフェニル) エチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシ-4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.84分;

25 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 613 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (777)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (2-チフェニルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシ-4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.71分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 587 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (778)

- 10 3- (N- ( (2- (2- ( ( (3S) -3-ヒドロキシメチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシ-4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

15 HPLC保持時間: 3.47分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 637 (M+H)<sup>+</sup>;

HPLC保持時間: 3.62分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 637 (M+H)<sup>+</sup>, 533.

実施例 4 (779)

- 20 3- (N- ( (2- (2- ( (3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシ-4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

25 HPLC保持時間: 3.82分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)<sup>+</sup>.



実施例 4 (780)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシ-4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.84分:

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 617 (M+H)<sup>+</sup>。

10 実施例 4 (781)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2-イル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシ-4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.18分:

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 610 (M+H)<sup>+</sup>, 596。

実施例 4 (782)

- 20 3- (N- ( (2- (2- ( (N- (2- (N, N-ジメチルアミノ) エチル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシ-4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.40分:

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 652 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (783)

- 5 3- (N- ( (2- (2- ( (2-フェニルエチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシ-4-メトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.82分:

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 595 (M+H)<sup>+</sup>。

10 実施例 4 (784)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシ-4-エトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.93分:

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 621 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (785)

- 20 3- (N- ( (2- (2- ( (N-ベンジル-N- (2-ヒドロキシエチル) アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシ-4-エトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.62分:

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 625 (M+H)<sup>+</sup>。

25 実施例 4 (786)

3- (N- ( (2- (2- (2-トリルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシ-4-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 3.67分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 571 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (787)

10 3- (N- ( (2- (2- (1-インダンアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシ-4-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H)<sup>+</sup>.

15

実施例 4 (788)

3- (N- ( (2- (2- (1-ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシ-4-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.95分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 631 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (789)

25 3- (N- ( (2- (2- (ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシ-4-

エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.22分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 582 (M+H)<sup>+</sup>.

5

実施例 4 (790)

3- (N- ( (2- (2- (ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシ-4-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.16分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 582 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (791)

15 3- (N- ( (2- (2- (1, 2, 3, 4-テトラヒドロインキノリン-2-イル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシ-4-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.82分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (792)

3- (N- ( (2- (2- (α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシ-4-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

25 HPLC測定条件: A

HPLC 保持時間 : 3.84 分 ;

MASS データ (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (793)

- 5 3- (N- ( (2- (2- (ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシ-4-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC 測定条件 : A

HPLC 保持時間 : 3.77 分 ;

- 10 MASS データ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (794)

- 3- (N- ( (2- (2- (2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシ-4-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC 測定条件 : A

HPLC 保持時間 : 3.78 分 ;

MASS データ (ESI, Pos., 20V) : 611 (M+H)<sup>+</sup>.

20 実施例 4 (795)

- 3- (N- ( (2- (2- (2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシ-4-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC 測定条件 : A

- 25 HPLC 保持時間 : 3.84 分 ;

MASS データ (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (796)

- 5 3- (N- ( (2- (2- (3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシ-4-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC 測定条件 : A

HPLC 保持時間 : 3.75 分 ;

MASS データ (ESI, Pos., 20V) : 611 (M+H)<sup>+</sup>.

10 実施例 4 (797)

- 3- (N- ( (2- (2- (4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシ-4-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC 測定条件 : A

- 15 HPLC 保持時間 : 3.89 分 ;

MASS データ (ESI, Pos., 20V) : 615 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (798)

- 20 3- (N- ( (2- (2- (4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシ-4-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC 測定条件 : A

HPLC 保持時間 : 3.75 分 ;

MASS データ (ESI, Pos., 20V) : 611 (M+H)<sup>+</sup>.

- 25

実施例 4 (799)

3- (N- ( (2- (2- ( (4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシ-4-エトキ  
シフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 595 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (800)

3- (N- ( (2- (2- ( (N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ  
ル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシ-4-  
エトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.80分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 595 (M+H)<sup>+</sup>。

15

実施例4 (801)

3- (N- ( (2- (2- ( (N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ  
ル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシ-4-  
エトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.88分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 609 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (802)

25 3- (N- ( (2- (2- ( (N-ブチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ  
ル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシ-4-

エトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸  
HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.06分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 637 (M+H)<sup>+</sup>, 388。

5

実施例4 (803)

3- (N- ( (2- (2- ( (4- (tert-ブチル) ベンジルアミノ) カルボニ  
ル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシ-4-  
エトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.10分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 637 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (804)

15 3- (N- ( (2- (2- ( (1-フエニル-3-ヒドロキシプロピルアミ  
ノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-メ  
トキシ-4-エトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.58分;

20 MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 625 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (805)

3- (N- ( (2- (2- ( (2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)  
フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシ-4-エト  
キシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

25 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間：3.78分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 599 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (806)

- 5 3-(N-(2-(2-(3-フルオロベンジルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(3-メトキシ-4-エトキシフエニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.80分；

- 10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 599 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (807)

- 3-(N-(2-(2-(2,5-ジフルオロベンジルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(3-メトキシ-4-エトキシフエニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.80分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 617 (M+H)<sup>+</sup>。

20 実施例4 (808)

- 3-(N-(2-(2-(2-(1R)-1-フエニル-2-ヒドロキシエチルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(3-メトキシ-4-エトキシフエニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

- 25 HPLC保持時間：3.58分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 611 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (809)

- 5 3-(N-(2-(2-(2-(2-クロロベンジルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(3-メトキシ-4-エトキシフエニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.89分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 615 (M+H)<sup>+</sup>。

10 実施例4 (810)

- 3-(N-(2-(2-(2-(4-フルオロベンジルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(3-メトキシ-4-エトキシフエニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

- 15 HPLC保持時間：3.78分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 599 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (811)

- 20 3-(N-(2-(2-(2-(アリルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(3-メトキシ-4-エトキシフエニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.60分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 531 (M+H)<sup>+</sup>。

- 25

実施例4 (812)

3- (N- ( (2- (2- ( (2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシ-4-エトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 3.77分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 617 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (813)

10 3- (N- ( (2- (2- ( (3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシ-4-エトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.88分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 615 (M+H)<sup>+</sup>。

15

実施例4 (814)

3- (N- ( (2- (2- ( ( (1S) -1-フエニル-2-ヒドロキシエチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシ-4-エトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.58分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 611 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (815)

25 3- (N- ( (2- (2- ( ( (1R) -1- (4-メチルフエニル) エチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-

メトキシ-4-エトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.91分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 609 (M+H)<sup>+</sup>。

5

実施例4 (816)

3- (N- ( (2- (2- ( (1- (4-フルオロフエニル) エチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシ-4-エトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 613 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (817)

15 3- (N- ( (2- (2- ( ( (2-チエニルメチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシ-4-エトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.73分;

20 MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 587 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (818)

3- (N- ( (2- (2- ( ( (3S) -3-ヒドロキシメチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシ-4-エトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.51分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 637 (M+H)<sup>+</sup>；

HPLC保持時間：3.66分；

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 637 (M+H)<sup>+</sup>, 533。

実施例4 (819)

3- (N- ( (2- (2- ( (3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシ-4-エトキ  
シフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.84分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)<sup>+</sup>。

15 実施例4 (820)

3- (N- ( (2- (2- ( (3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ  
ニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシ-4  
-エトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件：A

20 HPLC保持時間：3.84分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 617 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (821)

3- (N- ( (2- (2- ( (N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2  
-イル) メチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -  
N- (2- (3-メトキシ-4-エトキシフエニル) エチル) アミノ) プロ

ベン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.20分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 610 (M+H)<sup>+</sup>。

5

実施例4 (822)

3- (N- ( (2- (2- ( (N- (2- (N, N-ジメチルアミノ) エチ  
ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) カルボニル)  
-N- (2- (3-メトキシ-4-エトキシフエニル) エチル) アミノ) プ  
ロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.42分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 652 (M+H)<sup>+</sup>。

15 実施例4 (823)

3- (N- ( (2- (2- ( (2-フエニルエチルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシ-4-エトキ  
シフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件：A

20 HPLC保持時間：3.84分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (824)

3- (N- ( (2- (2- ( (1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチ  
ルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3,  
5-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.97分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H)<sup>+</sup>。

5 実施例4 (825)

3-(N-(2-(2-(N-ベンジル-N-(2-ヒドロキシエチル)

アミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(3,

5-ジメトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

10 HPLC保持時間：3.66分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 611 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (826)

3-(N-(2-(2-(2-トリルメチルアミノ)カルボニル)フェ

15 ニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(3, 5-ジメトキシフェニル)

エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.69分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)<sup>+</sup>。

20

実施例4 (827)

3-(N-(2-(2-(1-イソブチルアミノ)カルボニル)フェニル)

フェニル)カルボニル)-N-(2-(3, 5-ジメトキシフェニル)エチ

ル)アミノ)プロパン酸

25 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.89分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (828)

3-(N-(2-(2-(1-ナフチルメチルアミノ)カルボニル)フェ

5 ニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(3, 5-ジメトキシフェニ

ル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.97分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 617 (M+H)<sup>+</sup>。

10

実施例4 (829)

3-(N-(2-(2-(2-ピリジン-2-イルメチルアミノ)カルボニ

ル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(3, 5-ジメトキシ

フェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

15 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.25分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 568 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (830)

20 3-(N-(2-(2-(2-ピリジン-3-イルメチルアミノ)カルボニ

ル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(3, 5-ジメトキシ

フェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.20分；

25 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 568 (M+H)<sup>+</sup>。



実施例 4 (8.3.1)

3- (N- ( (2- (2- ( (1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3, 5-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (8.3.2)

10 3- (N- ( (2- (2- ( (α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3, 5-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.86分;

15 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (8.3.3)

3- (N- ( (2- (2- ( (ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3, 5-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.80分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)<sup>+</sup>.

25 実施例 4 (8.3.4)

3- (N- ( (2- (2- ( (2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3, 5-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.82分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 597 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (8.3.5)

10 3- (N- ( (2- (2- ( (2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3, 5-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.88分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>.

15 実施例 4 (8.3.6)

3- (N- ( (2- (2- ( (3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3, 5-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.78分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 597 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (8.3.7)

25 3- (N- ( (2- (2- ( (4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3, 5-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.93分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 601 (M+H)<sup>+</sup>。

5 実施例4 (838)

3-(N-(2-(2-(4-メトキシベンジルアミノ)カルボニル)

フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(3,5-ジメトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

10 HPLC保持時間：3.77分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 597 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (839)

3-(N-(2-(2-(4-メチルベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)

フェニル)カルボニル)-N-(2-(3,5-ジメトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

11 HPLC保持時間：3.88分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>。

20

実施例4 (840)

3-(N-(2-(2-(N-メチル-N-ベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)

フェニル)カルボニル)-N-(2-(3,5-ジメトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

25

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.84分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>。

5 実施例4 (841)

3-(N-(2-(2-(N-エチル-N-ベンジルアミノ)カルボニル)

フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(3,5-ジメトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

10 HPLC保持時間：3.91分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)<sup>+</sup>。

10 実施例4 (842)

3-(N-(2-(2-(N-ブチル-N-ベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)

フェニル)カルボニル)-N-(2-(3,5-ジメトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

15 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：4.10分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 623 (M+H)<sup>+</sup>。

20 実施例4 (843)

3-(N-(2-(2-(4-(tert-ブチル)ベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)

フェニル)カルボニル)-N-(2-(3,5-ジメトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

25 HPLC保持時間：4.11分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 623 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (8 4 4)

3- (N- ( (2- (2- ( (1-フェニル-3-ヒドロキシプロピルアミ  
ノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3, 5  
-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.62分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 611 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (8 4 5)

10 3- (N- ( (2- (2- ( (2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3, 5-ジメトキシフェ  
ニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.82分;

15 MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 585 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (8 4 6)

3- (N- ( (2- (2- ( (3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3, 5-ジメトキシフェ  
ニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.82分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 585 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (8 4 7)

3- (N- ( (2- (2- ( (2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3, 5-ジメトキ  
シフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.84分;

5 MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 603 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (8 4 8)

3- (N- ( (2- (2- ( ( (1R) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ  
チルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-  
(3, 5-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.64分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 597 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (8 4 9)

3- (N- ( (2- (2- ( (2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3, 5-ジメトキシフェニ  
ル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.89分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 601 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (8 5 0)

3- (N- ( (2- (2- ( (4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3, 5-ジメトキシフェ  
ニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.82分；

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 585 (M+H)<sup>+</sup>。

## 5 実施例4 (8.5.1)

3- (N- (2- (2- ( (トリルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3, 5-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件：A

10 HPLC保持時間：3.64分；

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 517 (M+H)<sup>+</sup>。

## 実施例4 (8.5.2)

15 3- (N- (2- (2- (2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3, 5-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.80分；

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 603 (M+H)<sup>+</sup>。

20

## 実施例4 (8.5.3)

3- (N- (2- (2- (3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3, 5-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

25 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.93分；

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 601 (M+H)<sup>+</sup>。

## 5 実施例4 (8.5.4)

5 3- (N- (2- (2- ( (1S) -1-フエニル-2-ヒドロキシエチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3, 5-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.62分；

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 597 (M+H)<sup>+</sup>。

10

## 実施例4 (8.5.5)

3- (N- (2- (2- ( (1R) -1- (4-メチルフエニル) エチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3, 5-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

15 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.95分；

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 595 (M+H)<sup>+</sup>。

## 20 実施例4 (8.5.6)

3- (N- (2- (2- ( (1- (4-フルオロフエニル) エチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3, 5-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.89分；

25 MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 599 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (8 5 7)

3- (N- (2- (2- (2-チエニルメチルアミノ) カルボニル) フ  
 エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3, 5-ジメトキシフエニ  
 ル) エチル) アミノ) フロバベン酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.75 分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 573 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (8 5 8)

10 3- (N- (2- (2- ( (3S) -3-ヒドロキシメチル-1, 2,  
 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル) フ  
 エニル) カルボニル) -N- (2- (3, 5-ジメトキシフエニル) エチル)  
 アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

15 HPLC保持時間: 3.53 分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 623 (M+H)<sup>+</sup>;

HPLC保持時間: 3.67 分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 623 (M+H)<sup>+</sup>, 519.

20 実施例 4 (8 5 9)

3- (N- (2- (2- (3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ  
 エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3, 5-ジメトキシフエニ  
 ル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

25 HPLC保持時間: 3.88 分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (8 6 0)

3- (N- (2- (2- (3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ  
 ニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3, 5-ジメトキ  
 シフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.88 分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 603 (M+H)<sup>+</sup>.

10 実施例 4 (8 6 1)

3- (N- (2- (2- (N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2  
 -イル) メチルアミノ) カルボニル) フエニル) カルボニル) -  
 N- (2- (3, 5-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

15 HPLC保持時間: 3.23 分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 596 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (8 6 2)

3- (N- (2- (2- (N- (N- (2- (N, N-ジメチルアミノ) エチ  
 ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル)  
 -N- (2- (3, 5-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.47 分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 638 (M+H)<sup>+</sup>.

25

実施例 4 (8 6 3)

3- (N- ( (2- (2- ( (2-フェニルエチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3, 5-ジメトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (8.6.4)

10 3- (N- ( (2- (2- ( (1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.13分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 591 (M+H)<sup>+</sup>.

15

実施例 4 (8.6.5)

3- (N- ( (2- (2- ( (N-ベンジル-N- (2-ヒドロキシエチル) アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.78分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (8.6.6)

25 3- (N- ( (2- (2- ( (2-フリルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

ル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 541 (M+H)<sup>+</sup>, 489.

5

実施例 4 (8.6.7)

3- (N- ( (2- (2- ( (1-イソダントアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.06分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (8.6.8)

15 3- (N- ( (2- (2- ( (1-ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.13分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 601 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (8.6.9)

3- (N- ( (2- (2- ( (ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

25 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間：3.36分；

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 552 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (870)

- 5 3-(N-(2-(2-(ピリジン-3-イルメチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(2-エトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.31分；

- 10 MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 552 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (871)

- 3-(N-(2-(2-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(2-エトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：4.00分；

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 577 (M+H)<sup>+</sup>。

20 実施例4 (872)

- 3-(N-(2-(2-(α-メチルベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(2-エトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：4.02分；

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 565 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (873)

- 5 3-(N-(2-(2-(ベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(2-エトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.97分；

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>。

10 実施例4 (874)

- 3-(N-(2-(2-(2-メトキシベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(2-エトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

15 HPLC保持時間：3.99分；

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (875)

- 20 3-(N-(2-(2-(2-メチルベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(2-エトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：4.04分；

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 565 (M+H)<sup>+</sup>。

25

実施例4 (876)

3- (N- (2- (2- (3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2-エトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 3.93分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (877)

3- (N- (2- (2- (4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2-エトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.10分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H)<sup>+</sup>.

15

#### 実施例 4 (878)

3- (N- (2- (2- (4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2-エトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.91分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (879)

25 3- (N- (2- (2- (4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2-エトキシフエニル) エ

チル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.04分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)<sup>+</sup>.

5

#### 実施例 4 (880)

3- (N- (2- (2- (N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2-エトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.99分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (881)

15 3- (N- (2- (2- (N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2-エトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.04分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 579 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (882)

3- (N- (2- (2- (N-ブチル-N-ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2-エトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

25 HPLC測定条件: A



HPLC保持時間：4.24分：

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (883)

- 5 3-(N-(2-(2-(4-(tert-ブチル)ベンジルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(2-エトキシフエニル)エチル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：4.28分：

- 10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (884)

- 3-(N-(2-(2-(1-フエニル-3-ヒドロキシプロピルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(2-エトキシフエニル)エチル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.79分：

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (885)

- 3-(N-(2-(2-(2-フルオロベンジルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(2-エトキシフエニル)エチル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

- 25 HPLC保持時間：3.97分：

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 569 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (886)

- 3-(N-(2-(2-(3-フルオロベンジルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(2-エトキシフエニル)エチル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.99分：

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 569 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (887)

- 3-(N-(2-(2-(2, 5-ジフルオロベンジルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(2-エトキシフエニル)エチル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

- 15 HPLC保持時間：4.00分：

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 587 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (888)

- 3-(N-(2-(2-(2-(1R)-1-フエニル-2-ヒドロキシエチルアミノ)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(2-エトキシフエニル)エチル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.78分：

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (889)

3- (N- ( (2- (2- (2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2-エトキシフエニル) エ  
チル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 4.06分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (890)

3- (N- ( (2- (2- (4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)  
フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2-エトキシフエニル)  
エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.97分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 569 (M+H)<sup>+</sup>。

15

実施例 4 (891)

3- (N- ( (2- (2- (7-リルアミノ) カルボニル) フエニル) フエ  
ニル) カルボニル) -N- (2- (2-エトキシフエニル) エチル) アミノ)  
フロバベン酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.80分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 501 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (892)

25 3- (N- ( (2- (2- (2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ  
ニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2-エトキシフエ

ニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.95分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 587 (M+H)<sup>+</sup>。

5

実施例 4 (893)

3- (N- ( (2- (2- (3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2-エトキシフエニル) エ  
チル) アミノ) フロバベン酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.10分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (894)

15 3- (N- ( (2- (2- ( (1S) -1-フエニル-2-ヒドロキシエ  
チルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2-  
(2-エトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.80分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (895)

25 3- (N- ( (2- (2- ( (1R) -1- (4-メチルフエニル) エチ  
ルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (2-  
-エトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間：4.10分；  
MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 579 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (896)

- 5 3-(N-(2-(2-(1-(4-フルオロフェニル)エチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(2-エトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：4.06分；

- 10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 583 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (897)

- 3-(N-(2-(2-(2-フェニルメチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(2-エトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.95分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (898)

- 3-(N-(2-(2-(3S)-3-ヒドロキシメチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(2-エトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

25 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.66分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H)<sup>+</sup>；  
HPLC保持時間：3.82分；  
MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (899)

- 5 3-(N-(2-(2-(3-メチルベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(2-エトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

- 10 HPLC保持時間：4.04分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (900)

- 3-(N-(2-(2-(3, 5-ジフルオロベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(2-エトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：4.04分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 587 (M+H)<sup>+</sup>。

20

実施例 4 (901)

- 3-(N-(2-(2-(N-メチル-N-(6-メチルピリジン-2-イル)メチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(2-エトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

25 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.36分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 580 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (9.02)

- 3 - (N - ( (2 - (2 - ( (N - (2 - (N, N - ジメチルアミノ) エチル) - N - ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) - N - (2 - (2 - エトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.58 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 622 (M+H)<sup>+</sup>。

10

実施例 4 (9.03)

- 3 - (N - ( (2 - (2 - ( (2 - フェニルエチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) - N - (2 - (2 - エトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

15 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.04 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (9.04)

- 20 3 - (N - ( (2 - (2 - ( (1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ-1-ナフチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) - N - (2 - (3 - エトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.08 分;

25 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 591 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (9.05)

- 3 - (N - ( (2 - (2 - ( (N - ベンジル - N - (2 - ヒドロキシエチル) アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) - N - (2 - (3 - エトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.75 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (9.06)

- 10 3 - (N - ( (2 - (2 - ( (2 - フリルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) - N - (2 - (3 - エトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.80 分;

15 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 541 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (9.07)

- 3 - (N - ( (2 - (2 - ( (1 - イソダニルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) - N - (2 - (3 - エトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.00 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)<sup>+</sup>。

25 

実施例 4 (9.08)

- 3 - (N - ( (2 - (2 - ( (1 - ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) - N - (2 - (3 - エトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

エニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシフエニル) エ  
チル) アミノ) フロバニ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.08分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 601 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (909)

3-(N-(2-(2-(ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニ  
ル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシフエニ  
ル) エチル) アミノ) フロバニ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.33分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 552 (M+H)<sup>+</sup>.

15 実施例 4 (910)

3-(N-(2-(2-(ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニ  
ル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシフエニ  
ル) エチル) アミノ) フロバニ酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.25分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 552 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (911)

3-(N-(2-(2-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン  
-2-イル) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-  
(3-エトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバニ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.97分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)<sup>+</sup>.

5 実施例 4 (912)

3-(N-(2-(2-( $\alpha$ -メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシフエニル) エ  
チル) アミノ) フロバニ酸

HPLC測定条件: A

10 HPLC保持時間: 3.99分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (913)

3-(N-(2-(2-(ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フ  
エニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシフエニル) エチル) アミ  
ノ) フロバニ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.91分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>.

20

実施例 4 (914)

3-(N-(2-(2-(2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)  
フエニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシフエニル)  
エチル) アミノ) フロバニ酸

25 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.91分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (9.1.5)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシフエニル) エ  
チル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.97 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)<sup>+</sup>.

10

実施例 4 (9.1.6)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシフエニル) エ  
チル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.88 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (9.1.7)

- 20 3- (N- ( (2- (2- ( (4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシフエニル) エ  
チル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.04 分;

25 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 585 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (9.1.8)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシフエニル) エ  
チル) アミノ) フロバベン酸

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.88 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>.

10

実施例 4 (9.1.9)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシフエニル) エ  
チル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.99 分;

15 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (9.2.0)

- 20 3- (N- ( (2- (2- ( (N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ  
ル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシフエニ  
ル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.93 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)<sup>+</sup>.

25 実施例 4 (9.2.1)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.00 分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 579 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (9.2.2)

3- (N- ( (2- (2- ( (N-フェニル-N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.19 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H)<sup>+</sup>。

15 実施例 4 (9.2.3)

3- (N- ( (2- (2- ( (4- (tert-フェニル) ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 4.22 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (9.2.4)

25 3- (N- ( (2- (2- ( (1-フェニル-3-ヒドロキシフロビルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.71 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 595 (M+H)<sup>+</sup>。

5 実施例 4 (9.2.5)

3- (N- ( (2- (2- ( (2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

10 HPLC保持時間: 3.91 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 569 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (9.2.6)

15 3- (N- ( (2- (2- ( (3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.93 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 569 (M+H)<sup>+</sup>。

20

実施例 4 (9.2.7)

3- (N- ( (2- (2- ( (2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシフェニル) エチル) アミノ) フロバベン酸

25 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.95 分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 587 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (928)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (1R) -1-フェニル-2-ヒドロキシエチル) アミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノール

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.73分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>.

10

実施例 4 (929)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (2-クロロベンジル) アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノール

15 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.00分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 585 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (930)

- 20 3- (N- ( (2- (2- ( (4-フルオロベンジル) アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノール

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.91分;

25 MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 569 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (931)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (2-フルル) アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノール

5 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.75分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 501 (M+H)<sup>+</sup>.

10

実施例 4 (932)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (2, 6-ジフルオロベンジル) アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノール

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.89分;

15 MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 587 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (933)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (3-クロロベンジル) アミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノール

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.04分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 585 (M+H)<sup>+</sup>.

25 実施例 4 (934)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (1S) -1-フェニル-2-ヒドロキシエ



チルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-  
(3-エトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.73分;

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (9.3.5)

3-(N-(2-(2-(1-(1R)-1-(4-メチルフエニル) エチ  
ルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-(3  
-エトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.06分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 579 (M+H)<sup>+</sup>.

15 実施例 4 (9.3.6)

3-(N-(2-(2-(1-(4-フルオロフエニル) エチルアミノ)  
カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキ  
シフエニル) エチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.99分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 583 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (9.3.7)

3-(N-(2-(2-(2-(2-チエニルメチルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシフエニル) エ  
チル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.88分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)<sup>+</sup>.

5 実施例 4 (9.3.8)

3-(N-(2-(2-(2-(3S)-3-ヒドロキシメチル-1, 2,  
3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル) フエニル) フ  
エニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシフエニル) エチル) アミ  
ノ) フロバノン酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.62分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H)<sup>+</sup>;

HPLC保持時間: 3.77分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 607 (M+H)<sup>+</sup>.

15

#### 実施例 4 (9.3.9)

3-(N-(2-(2-(2-(3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシフエニル) エ  
チル) アミノ) フロバノン酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.97分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (9.4.0)

25 3-(N-(2-(2-(2-(3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ  
ニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N-(2-(3-エトキシフエ

ニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.97 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 587 (M+H)<sup>+</sup>.

5

#### 実施例 4 (9.4.1)

3- (N- ( (2- (2- ( (N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2-  
-イル) メチルアミノ) カルボニル) フエニル) カルボニル) -  
N- (2- (3-エトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.33 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 580 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (9.4.2)

15 3- (N- ( (2- (2- ( (N- (2- (N, N-ジメチルアミノ) エチ  
ル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) カルボニル)  
-N- (2- (3-エトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.53 分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 622 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (9.4.3)

25 3- (N- ( (2- (2- ( (2-フエニルエチルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-エトキシフエニル) エ  
チル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.97 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (9.4.4)

5 3- (N- ( (2- (2- ( (1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチ  
ルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (3-フ  
エニルプロピル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.06 分;

10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 561 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (9.4.5)

15 3- (N- ( (2- (2- ( (N-ベンジル-N- (2-ヒドロキシエチル)  
アミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (3-フエ  
ニルプロピル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.73 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例 4 (9.4.6)

20 3- (N- ( (2- (2- ( (1-ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) -N- (3-フエニルプロピル) アミノ)  
プロパノ酸

HPLC測定条件: A

25 HPLC保持時間: 4.04 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 571 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (9.4.7)

3- (N- ( (2- (2- ( (ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (3-フエニルプロピル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.33 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)<sup>+</sup>.

10 実施例 4 (9.4.8)

3- (N- ( (2- (2- ( (α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (3-フエニルプロピル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

15 HPLC保持時間: 3.97 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (9.4.9)

20 3- (N- ( (2- (2- ( (2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (3-フエニルプロピル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.97 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)<sup>+</sup>.

25 実施例 4 (9.5.0)

3- (N- ( (2- (2- ( (4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (3-フエニルプロピル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 4.02 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (9.5.1)

10 3- (N- ( (2- (2- ( (N-イソプロピル-N-ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (3-フエニルプロピル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.06 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 563 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (9.5.2)

15 3- (N- ( (2- (2- ( (N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (3-フエニルプロピル) アミノ) フロバノン酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.99 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (9.5.3)

25 3- (N- ( (2- (2- ( (N-チル-N-ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (3-フエニルプロピル) アミノ) フロバノン酸

ミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.19 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)<sup>+</sup>。

5

実施例 4 (9.5.4)

3- (N- ( (2- (2- ( (4- (tert-ブチル) ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (3-フエニルフロピル) アミノ) フロバベン酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.19 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (9.5.5)

15 3- (N- ( (2- (2- ( (1-フエニル-3-ヒドロキシフロピルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (3-フエニルフロピル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.73 分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (9.5.6)

3- (N- ( (2- (2- ( (2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (3-フエニルフロピル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.93 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (9.5.7)

5 3- (N- ( (2- (2- ( ( (1R) -1-フエニル-2-ヒドロキシエチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (3-フエニルフロピル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.73 分;

10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (9.5.8)

3- (N- ( (2- (2- ( (2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (3-フエニルフロピル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.99 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (9.5.9)

3- (N- ( (2- (2- ( (3-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (3-フエニルフロピル) アミノ) フロバベン酸

HPLC測定条件: A

25 HPLC保持時間: 4.02 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (9.6.0)

3- (N- ( (2- (2- ( (1S) -1-フェニル-2-ヒドロキシエチルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (3-フェニルプロピル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.73分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>.

10 実施例 4 (9.6.1)

3- (N- ( (2- (2- ( (1R) -1- (4-メチルフェニル) エチルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (3-フェニルプロピル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

15 HPLC保持時間: 4.06分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (9.6.2)

3- (N- ( (2- (2- ( (1- (4-フルオロフェニル) エチルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (3-フェニルプロピル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.99分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 553 (M+H)<sup>+</sup>.

25

実施例 4 (9.6.3)

3- (N- ( (2- (2- ( (3S) -3-ヒドロキシメチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (3-フェニルプロピル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 3.62分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)<sup>+</sup>;

HPLC保持時間: 3.75分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)<sup>+</sup>, 473.

10 実施例 4 (9.6.4)

3- (N- ( (2- (2- ( (3-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (3-フェニルプロピル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

15 HPLC保持時間: 3.97分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (9.6.5)

3- (N- ( (2- (2- ( (N-メチル-N- (6-メチルピリジン-2-イル) メチルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (3-フェニルプロピル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.31分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 550 (M+H)<sup>+</sup>.

25

実施例 4 (9.6.6)

3- (N- ( (2- (2- ( (N- (2- (N, N-ジメチルアミノ) エチル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (3-フェニルプロピル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 3.55分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 592 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (967)

10 3- (N- ( (2- (2- ( (1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-ナフチルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.93分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 533 (M+H)<sup>+</sup>。

15

実施例 4 (968)

3- (N- ( (2- (2- ( (N-ベンジル-N- (2-ヒドロキシエチル) アミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロパノ酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.60分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (969)

25 3- (N- ( (2- (2- ( (1-ナフチルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A  
HPLC保持時間: 3.93分;  
MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 543 (M+H)<sup>+</sup>。

5 実施例 4 (970)

3- (N- ( (2- (2- ( (α-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.84分;

10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 507 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (971)

3- (N- ( (2- (2- ( (2-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロパノ酸

15 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.82分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 507 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (972)

20 3- (N- ( (2- (2- ( (4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.89分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 527 (M+H)<sup>+</sup>。

25 実施例 4 (973)

3- (N- ( (2- (2- (N-エチル-N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 521 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (974)

10 3- (N- ( (2- (2- (N-ブチル-N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.08分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)<sup>+</sup>.

15

実施例 4 (975)

3- (N- ( (2- (2- ( (4- (tert-ブチル) ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロパノ酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.10分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (976)

25 3- (N- ( (2- (2- ( (1-フェニル-3-ヒドロキシプロピルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) ア

ミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.60分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H)<sup>+</sup>.

5

実施例 4 (977)

3- (N- ( (2- (2- ( (2, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロパノ酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.80分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 529 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (978)

15 3- (N- ( (2- (2- ( ( (1R) -1-フェニル-2-ヒドロキシエチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.56分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 523 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (979)

3- (N- ( (2- (2- ( (2-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロパノ酸

25 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.88分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 527 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (980)

- 3 - (N - ( (2 - (2 - ( (3 - クロロベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フエニル) カルボニル) - N - (ベンジル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.89 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 527 (M+H)<sup>+</sup>.

10 実施例 4 (981)

- 3 - (N - ( (2 - (2 - ( (1 S) - 1 - フエニル-2 - ヒドロキシエ  
チルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) - N - (ベン  
ジル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

- 15 HPLC保持時間: 3.58 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 523 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (982)

- 3 - (N - ( (2 - (2 - ( (1 R) - 1 - (4 - メチルフエニル) エチ  
ルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) - N - (ベンジ  
ル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.93 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 521 (M+H)<sup>+</sup>.

25

実施例 4 (983)

365

- 3 - (N - ( (2 - (2 - ( (1 - (4 - フルオロフエニル) エチルアミノ)  
カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) - N - (ベンジル) アミノ)  
プロパノ酸

HPLC測定条件: A

- 5 HPLC保持時間: 3.86 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 525 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (984)

- 3 - (N - ( (2 - (2 - ( ( (3 S) - 3 - ヒドロキシメチル-1, 2,  
3, 4 - テトラヒドロイソキノリン-2 - イル) カルボニル) フエニル) フ  
エニル) カルボニル) - N - (ベンジル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.49 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)<sup>+</sup>;

- 15 HPLC保持時間: 3.62 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)<sup>+</sup>, 445.

実施例 4 (985)

- 3 - (N - ( (2 - (2 - ( (N - メチル-N - (6 - メチルピリジン-2  
- イル) メチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -  
N - (ベンジル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.16 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)<sup>+</sup>, 508.

25

実施例 4 (986)

366



3- (N- ( (2- (2- ( (N- (2- (N, N-ジメチルアミノ) エチル) -N-ベンジルアミノ) カルボニル) アミノ) アミノ) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロパノール

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 3.40分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 564 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (987)

10 3- (N- ( (2- (2- ( (2- (2- (1-メチル-3-アミノプロピルアミノ) カルボニル) -4-メチルアミノ) -5-メチルアミノ) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシアミノ) エチル) アミノ) プロパノール

HPLC測定条件: B

HPLC保持時間: 3.59分:

MASSデータ (ESI, Pos.) : 580 (M+H)<sup>+</sup>, 472.

15

実施例 4 (988)

3- (N- ( (2- (2- ( (1-メチル-3-アミノプロピルアミノ) カルボニル) アミノ) アミノ) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシアミノ) エチル) アミノ) プロパノール

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.99分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 579 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (989)

25 3- (N- ( (2- (2- ( (4-アミノベンジルアミノ) カルボニル) -4-メチルアミノ) -5-メチルアミノ) カルボニル) -N- (2-

(4-エトキシアミノ) エチル) アミノ) プロパノール

HPLC測定条件: B

HPLC保持時間: 4.53分:

MASSデータ (ESI, Pos.) : 597 (M+H)<sup>+</sup>, 525.

5

実施例 4 (990)

3- (N- ( (2- (2- ( (1-メチル-3-アミノプロピルアミノ) カルボニル) アミノ) アミノ) カルボニル) -N- (2- (2-アミノエチル) アミノ) プロパノール

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.00分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (991)

15 3- (N- ( (2- (2- ( (2- (2- (1-メチル-3-アミノプロピルアミノ) カルボニル) アミノ) アミノ) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシアミノ) エチル) アミノ) プロパノール

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.69分:

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 527 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (992)

25 3- (N- ( (2- (2- ( (1-イソプロピルアミノ) カルボニル) アミノ) アミノ) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシアミノ) エチル) アミノ) プロパノール

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間：3.89分；

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 563 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (993)

- 5 3-(N-(2-(2-(ピリジン-2-イルメチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(3-メトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.23分；

- 10 MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 538 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (994)

- 3-(N-(2-(2-(ピリジン-3-イルメチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(3-メトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.18分；

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 538 (M+H)<sup>+</sup>。

20 実施例 4 (995)

- 3-(N-(2-(2-(ピリジン-4-イルメチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(3-メトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

- 25 HPLC保持時間：3.2分；

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 538 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (996)

- 3-(N-(2-(2-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(3-メトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.84分；

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 563 (M+H)<sup>+</sup>。

10 実施例 4 (997)

- 3-(N-(2-(2-(ベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(3-メトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

- 15 HPLC保持時間：3.8分；

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 537 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (998)

- 3-(N-(2-(2-(2-メトキシベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(3-メトキシフェニル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.82分；

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 567 (M+H)<sup>+</sup>。

- 25

実施例 4 (999)

3- (N- ( (2- (2- (3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバノン酸  
HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 3.78分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (1000)

10 3- (N- ( (2- (2- (4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバノン酸  
HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.88分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>.

15

実施例 4 (1001)

3- (N- ( (2- (2- (N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバノン酸  
HPLC測定条件: A

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.82分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (1002)

25 3- (N- ( (2- (2- (2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシフエニル)

エチル) アミノ) フロバノン酸  
HPLC測定条件: A  
HPLC保持時間: 3.80分;  
MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)<sup>+</sup>.

5

実施例 4 (1003)

3- (N- ( (2- (2- (3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバノン酸  
HPLC測定条件: A

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.82分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (1004)

15 3- (N- ( (2- (2- (7-リルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバノン酸  
HPLC測定条件: A

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.64分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 995 (2M+Na)<sup>+</sup>, 487 (M+H)<sup>+</sup>.

20

実施例 4 (1005)

25 3- (N- ( (2- (2- (2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2- (3-メトキシフエニル) エチル) アミノ) フロバノン酸  
HPLC測定条件: A

HPLC保持時間：3.78分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 573 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (1006)

- 5 3-(N-(2-(2-(2-チエニルメチルアミノ)カルボニル)フ  
エニル)フエニル)カルボニル)-N-(2-(3-メトキシフエニル)エ  
チル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.78分；

- 10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 543 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (1007)

- 3-(N-(2-(2-(2-フリルメチルアミノ)カルボニル)フエ  
ニル)フエニル)カルボニル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)アミ  
ノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.03分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 967 (2M+H)<sup>+</sup>, 484 (M+H)<sup>+</sup>.

- 20 実施例 4 (1008)

3-(N-(2-(2-(1-イソブチルアミノ)カルボニル)フエニル)  
フエニル)カルボニル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)アミノ)プロ  
パノ酸

HPLC測定条件：A

- 25 HPLC保持時間：3.20分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 520 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (1009)

- 5 3-(N-(2-(2-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン  
-2-イル)カルボニル)フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(ピリ  
ジン-3-イルメチル)アミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.21分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 520 (M+H)<sup>+</sup>.

- 10 実施例 4 (1010)

3-(N-(2-(2-(2-メトキシベンジルアミノ)カルボニル)  
フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)ア  
ミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

- 15 HPLC保持時間：3.14分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 524 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (1011)

- 20 3-(N-(2-(2-(3-メトキシベンジルアミノ)カルボニル)  
フエニル)フエニル)カルボニル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)ア  
ミノ)プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.11分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 524 (M+H)<sup>+</sup>.

- 25

実施例 4 (1012)

3- (N- ( (2- (2- (4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (ピリジン-3-イルメチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 3.09分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 524 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1013)

10 3- (N- ( (2- (2- (4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (ピリジン-3-イルメチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.18分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 508 (M+H)<sup>+</sup>。

15

実施例 4 (1014)

3- (N- ( (2- (2- (N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (ピリジン-3-イルメチル) アミノ) フロバノン酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.20分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 508 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1015)

25 3- (N- ( (2- (2- (2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (ピリジン-3-イルメチル) ア

ミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.10分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 512 (M+H)<sup>+</sup>。

5

実施例 4 (1016)

3- (N- ( (2- (2- (3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (ピリジン-3-イルメチル) アミノ) フロバノン酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.14分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 512 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1017)

15 3- (N- ( (2- (2- (4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (ピリジン-3-イルメチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.12分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 512 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1018)

25 3- (N- ( (2- (2- (アリルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (ピリジン-3-イルメチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間：2.94分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 887 (M+H)<sup>+</sup>, 444 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (1019)

- 5 3-(N-(2-(2-(2,6-ジフルオロベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.11分；

- 10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 530 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (1020)

- 3-(N-(2-(2-(2-チエニルメチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(ピリジン-3-イルメチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.09分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 500 (M+H)<sup>+</sup>.

20 実施例 4 (1021)

- 3-(N-(2-(2-(1-インダンアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(ピリジン-2-イル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

- 25 HPLC保持時間：3.20分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 534 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (1022)

- 5 3-(N-(2-(2-(ピリジン-2-イルメチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(ピリジン-2-イル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：2.72分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 509 (M+H)<sup>+</sup>, 255.

10 実施例 4 (1023)

- 3-(N-(2-(2-(ピリジン-3-イルメチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(ピリジン-2-イル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

- 15 HPLC保持時間：2.72分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 509 (M+H)<sup>+</sup>, 255.

実施例 4 (1024)

- 20 3-(N-(2-(2-(1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(ピリジン-2-イル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.25分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 534 (M+H)<sup>+</sup>.

- 25

実施例 4 (1025)

3- (N- (2- (2- (2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-2-イル) エ  
チル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 3.13分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例4 (1026)

3- (N- (2- (2- (3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

10 フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-2-イル) エ  
チル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.11分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)<sup>+</sup>.

15

実施例4 (1027)

3- (N- (2- (2- (4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-2-イル) エ  
チル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.11分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例4 (1028)

25 3- (N- (2- (2- (4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェ  
ニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-2-イル) エチ

ル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.20分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)<sup>+</sup>.

5

実施例4 (1029)

3- (N- (2- (2- (N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ  
ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-2-イル) エ  
チル) アミノ) フロバノン酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.22分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例4 (1030)

15 3- (N- (2- (2- (2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-2-イル) エ  
チル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.12分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 526 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例4 (1031)

25 3- (N- (2- (2- (3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-2-イル) エ  
チル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間：3.14分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 526 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (1032)

5 3-(N-(2-(2-(4-フルオロベンジルアミノ)カルボニル)

フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(ピリジン-2-イル)エ

チル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.14分；

10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 526 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (1033)

3-(N-(2-(2-(7-フルアミノ)カルボニル)フェニル)フェ

ニル)カルボニル)-N-(2-(ピリジン-2-イル)エチル)アミノ

15 プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：2.94分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 458 (M+H)<sup>+</sup>。

20 実施例4 (1034)

3-(N-(2-(2-(2,6-ジフルオロベンジルアミノ)カルボ

ニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(ピリジン-2-イ

ル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

25 HPLC保持時間：3.11分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 544 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (1035)

3-(N-(2-(2-(2-チエニルメチルアミノ)カルボニル)フェ

ニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(ピリジン-2-イル)エチ

5 ル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.09分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 514 (M+H)<sup>+</sup>。

10 実施例4 (1036)

3-(N-(2-(2-(3,5-ジフルオロベンジルアミノ)カルボ

ニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(ピリジン-2-イ

ル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

15 HPLC保持時間：3.18分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 544 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例4 (1037)

3-(N-(2-(2-(2-フェニルエチルアミノ)カルボニル)フェ

20 ニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(ピリジン-2-イル)エチ

ル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.16分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)<sup>+</sup>。

25

実施例4 (1038)



3- (N- (2- (2- (2-トリルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (1-メチル-3-フェニルプロピル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 3.84分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 525 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1039)

3- (N- (2- (2- (1-インドルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (1-メチル-3-フェニルプロピル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.02分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 561 (M+H)<sup>+</sup>。

15

実施例 4 (1040)

3- (N- (2- (2- (ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (1-メチル-3-フェニルプロピル) アミノ) プロパン酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.38分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 536 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1041)

25 3- (N- (2- (2- (ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (1-メチル-3-フェニル

プロピル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.27分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 536 (M+H)<sup>+</sup>。

5

実施例 4 (1042)

3- (N- (2- (2- (1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (1-メチル-3-フェニルプロピル) アミノ) プロパン酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.00分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 561 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1043)

15 3- (N- (2- (2- (ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (1-メチル-3-フェニルプロピル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.93分:

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1044)

25 3- (N- (2- (2- (2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (1-メチル-3-フェニルプロピル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間：3.95分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1045)

- 5 3- (N- ( (2- (2- ( (3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (1-メチル-3-フェニルプロ  
ピル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.91分；

- 10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1046)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (1-メチル-3-フェニルプロ  
ピル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.89分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)<sup>+</sup>。

20 実施例 4 (1047)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ  
ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (1-メチル-3-フェニルプロピ  
ル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件：A

- 25 HPLC保持時間：4.00分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1048)

- 5 3- (N- ( (2- (2- ( (N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ  
ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (1-メチル-3-フェニル  
プロピル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.99分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 549 (M+H)<sup>+</sup>。

10 実施例 4 (1049)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (1-メチル-3-フェニルプロ  
ピル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件：A

- 15 HPLC保持時間：3.97分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 553 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1050)

- 20 3- (N- ( (2- (2- ( (4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (1-メチル-3-フェニルプロ  
ピル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.95分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 553 (M+H)<sup>+</sup>。

25 実施例 4 (1051)

3- (N- ( (2- (2- ( (アリルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (1-メチル-3-フエニルプロピル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 3.78 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 485 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (1052)

3- (N- ( (2- (2- ( (2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (1-メチル-3-フエニルプロピル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.93 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 571 (M+H)<sup>+</sup>.

15

実施例 4 (1053)

3- (N- ( (2- (2- ( (2-チエニルメチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (1-メチル-3-フエニルプロピル) アミノ) プロパノ酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.89 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 541 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (1054)

25 3- (N- ( (2- (2- ( (2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2-メトキシフエニル)

エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.86 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)<sup>+</sup>.

5

実施例 4 (1055)

3- (N- ( (2- (2- ( (3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2-メトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.84 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (1056)

15 3- (N- ( (2- (2- ( (4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2-メトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.82 分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (1057)

3- (N- ( (2- (2- ( (4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2-メトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

25 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間 : 3.93 分 ;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1058)

- 5 3- (N- ( (2- (2- ( (N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件 : A

HPLC保持時間 : 3.86 分 ;

- 10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>, 537。

実施例 4 (1059)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件 : A

HPLC保持時間 : 3.86 分 ;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)<sup>+</sup>。

20 実施例 4 (1060)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件 : A

- 25 HPLC保持時間 : 3.89 分 ;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1061)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (アリルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件 : A

HPLC保持時間 : 3.69 分 ;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 487 (M+H)<sup>+</sup>。

10 実施例 4 (1062)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (3, 5-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件 : A

- 15 HPLC保持時間 : 3.95 分 ;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 573 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1063)

- 20 3- (N- ( (2- (2- ( (2-フェニルエチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2-メトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件 : A

HPLC保持時間 : 3.91 分 ;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>。

- 25

実施例 4 (1064)

3- (N- (2- (2- (2-トリルメチルアミノ) カルボニル) ア  
ニル) アニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-4-イル) エチル)  
アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 3.01分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 498 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1065)

10 3- (N- (2- (2- (1-イソタンアミノ) カルボニル) アニル)  
アニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-4-イル) エチル) ア  
ミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.18分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 534 (M+H)<sup>+</sup>, 418。

15

実施例 4 (1066)

3- (N- (2- (2- (ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニ  
ル) アニル) アニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-4-イル)  
エチル) アミノ) プロパン酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 2.70分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 509 (M+H)<sup>+</sup>, 255。

実施例 4 (1067)

25 3- (N- (2- (2- (1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン  
-2-イル) カルボニル) アニル) アニル) カルボニル) -N- (2-

(ピリジン-4-イル) エチル) アミノ) プロパン酸  
HPLC測定条件: A  
HPLC保持時間: 3.20分;  
MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 534 (M+H)<sup>+</sup>。

5

実施例 4 (1068)

3- (N- (2- (2- (2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)  
アニル) アニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-4-イル) エ  
チル) アミノ) プロパン酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.12分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1069)

15 3- (N- (2- (2- (3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)  
アニル) アニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-4-イル) エ  
チル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.11分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1070)

25 3- (N- (2- (2- (4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)  
アニル) アニル) カルボニル) -N- (2- (ピリジン-4-イル) エ  
チル) アミノ) プロパン酸  
HPLC測定条件: A

HPLC保持時間：3.09分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 538 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1071)

- 5 3-(N-(2-(4-メチルベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニルカルボニル)-N-(2-(ピリジン-4-イル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.16分；

- 10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1072)

- 3-(N-(2-(2-(N-メチル-N-ベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(ピリジン-4-イル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.16分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)<sup>+</sup>。

- 20 実施例 4 (1073)

3-(N-(2-(2-(トリルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(ピリジン-4-イル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

- 25 HPLC保持時間：2.92分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 915 (2M+H)<sup>+</sup>, 458 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1074)

- 5 3-(N-(2-(2-(2,6-ジフルオロベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(ピリジン-4-イル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.09分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 544 (M+H)<sup>+</sup>, 272。

- 10 実施例 4 (1075)

3-(N-(2-(2-(3,5-ジフルオロベンジルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(ピリジン-4-イル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

- 15 HPLC保持時間：3.18分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 544 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1076)

- 20 3-(N-(2-(2-(2-フェニルエチルアミノ)カルボニル)フェニル)フェニル)カルボニル)-N-(2-(ピリジン-4-イル)エチル)アミノ)プロパン酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.14分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)<sup>+</sup>, 261。

- 25

実施例 4 (1077)

3- (N- (2- (2- (1-インダンアミノ) カルボニル) フェニル)  
フェニル) カルボニル) -N- (2-フェニルエチル) アミノ) プロパノ酸  
HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.89分:

5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 533 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (1078)

3- (N- (2- (2- (ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-フェニルエチル) アミ

10 ノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.18分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 508 (M+H)<sup>+</sup>.

15 実施例 4 (1079)

3- (N- (2- (2- (1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン  
-2-イル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-

フェニルエチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.86分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 533 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (1080)

3- (N- (2- (2- (2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-フェニルエチル) アミノ)

25 プロパノ酸

HPLC測定条件: A  
HPLC保持時間: 3.84分:  
MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H)<sup>+</sup>.

5 実施例 4 (1081)

3- (N- (2- (2- (3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-フェニルエチル) アミ

ノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

10 HPLC保持時間: 3.80分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (1082)

3- (N- (2- (2- (4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-フェニルエチル) アミ

15 ノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.78分:

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 537 (M+H)<sup>+</sup>.

20

実施例 4 (1083)

3- (N- (2- (2- (4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ  
ェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-フェニルエチル) アミ) ノ  
プロパノ酸

25 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.91分:

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 521 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1084)

- 3 - (N - ( (2 - (2 - (N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N - (2-フェニルエチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.84 分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 521 (M+H)<sup>+</sup>。

10

実施例 4 (1085)

- 3 - (N - ( (2 - (2 - (3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N - (2-フェニルエチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.86 分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 525 (M+H)<sup>+</sup>。

15

実施例 4 (1086)

- 20 3 - (N - ( (2 - (2 - (4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N - (2-フェニルエチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.84 分;

- 25 MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 525 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1087)

- 3 - (N - ( (2 - (2 - (アリルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N - (2-フェニルエチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

- 5 HPLC保持時間: 3.62 分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 457 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1088)

- 3 - (N - ( (2 - (2 - (2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N - (2-フェニルエチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.80 分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 543 (M+H)<sup>+</sup>。

15

実施例 4 (1089)

- 3 - (N - ( (2 - (2 - (2-チエニルメチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N - (2-フェニルエチル) アミノ) フロバノン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.78 分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 513 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1090)

- 25 3 - (N - ( (2 - (2 - (2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N - (2 - (4-メトキシフェニル)



エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.80 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)<sup>+</sup>。

5

実施例 4 (1091)

3- (N- ( (2- (2- ( (3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メトキシフェニル)  
エチル) アミノ) プロパノ酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.77 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1092)

15 3- (N- ( (2- (2- ( (4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メトキシフェニル)  
エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.75 分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 567 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1093)

3- (N- ( (2- (2- ( (4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェ  
ニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メトキシフェニル) エ  
チル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.86 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1094)

5 3- (N- ( (2- (2- ( (N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ  
ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メトキシフェ  
ニル) エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.80 分;

10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1095)

3- (N- ( (2- (2- ( (3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-メトキシフェニル)  
エチル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.80 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 555 (M+H)<sup>+</sup>。

20 実施例 4 (1096)

3- (N- ( (2- (2- ( (トリルアミノ) カルボニル) フェ  
ニル) カルボニル) -N- (2- (4-メトキシフェニル) エチル) アミノ)  
プロパノ酸

HPLC測定条件: A

25 HPLC保持時間: 3.60 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 487 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1097)

3- (N- ( (2- (2- (1-イソタンアミノ) カルボニル) フェニル)  
フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 4-ジクロロフェニル) エチル)

5 アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.15分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 601 (M+H)<sup>+</sup>.

10 実施例 4 (1098)

3- (N- ( (2- (2- (ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 4-ジクロロ  
フェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

15 HPLC保持時間: 3.34分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 576 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (1099)

3- (N- ( (2- (2- (1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン  
-2-イル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-  
(2, 4-ジクロロフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.10分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 601 (M+H)<sup>+</sup>.

25 実施例 4 (1100)

3- (N- ( (2- (2- (2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 4-ジクロロフェ  
ニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 4.08分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 605 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (1101)

3- (N- ( (2- (2- (3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 4-ジクロロフェ  
ニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.06分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 605 (M+H)<sup>+</sup>.

15

実施例 4 (1102)

3- (N- ( (2- (2- (4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 4-ジクロロフェ  
ニル) エチル) アミノ) プロパン酸

20 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.13分;

MASSデータ (ESI, Pos, 20V) : 589 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (1103)

25 3- (N- ( (2- (2- (N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ  
ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 4-ジクロロフ

エニル) エチル) テミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.08 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 589 (M+H)<sup>+</sup>.

5

実施例 4 (1104)

3- (N- ( (2- (2- ( (3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 4-ジクロロフェニル)

ル) エチル) テミノ) プロパン酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.06 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 593 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (1105)

15 3- (N- ( (2- (2- ( (アリルアミノ) カルボニル) フェニル) フェ

ニル) カルボニル) -N- (2- (2, 4-ジクロロフェニル) エチル) ア

ミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.88 分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 525 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (1106)

3- (N- ( (2- (2- ( (2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 4-ジクロロ

25 フェニル) エチル) テミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.04 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 611 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (1107)

5 3- (N- ( (2- (2- ( (2-チエニルメチルアミノ) カルボニル) フ

エニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (2, 4-ジクロロフェニル)

エチル) テミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 4.04 分;

10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (1108)

3- (N- ( (2- (2- ( (2-フルリルメチルアミノ) カルボニル) フェ

ニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフェニル) エチ

15 ル) テミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.80 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 541 (M+H)<sup>+</sup>.

20 実施例 4 (1109)

3- (N- ( (2- (2- ( (1-イソブチルアミノ) カルボニル) フェニル)

フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフェニル) エチル) ア

ミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

25 HPLC保持時間: 3.99 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (1110)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (1, 2, 3, 4-テトラヒドロキシリソ  
-2-イル) カルボニル) フェニル) カルボニル) -N- (2-  
(4-エトキシフェニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.93 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 577 (M+H)<sup>+</sup>.10 実施例 4 (1111)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフェニル)  
エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.91 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>.実施例 4 (1112)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフェニル)  
エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.87 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 581 (M+H)<sup>+</sup>.

25

実施例 4 (1113)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フ  
エニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフェニル) エ  
チル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.99 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)<sup>+</sup>.実施例 4 (1114)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニ  
ル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフェニ  
ル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.91 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 565 (M+H)<sup>+</sup>.

15

実施例 4 (1115)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフェニル)  
エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.91 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 569 (M+H)<sup>+</sup>.実施例 4 (1116)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフェニル)

25

エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.93 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 569 (M+H)<sup>+</sup>。

5

実施例 4 (1117)

3- (N- ( (2- (2- (4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフェニル)

エチル) アミノ) プロパン酸

10 HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.89 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 569 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1118)

15 3- (N- ( (2- (2- (アリルアミノ) カルボニル) フェニル) フェ

ニル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフェニル) エチル) アミノ)

プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.73 分;

20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 501 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1119)

3- (N- ( (2- (2- (2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフェ

25 ニル) エチル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.88 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 587 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1120)

5

3- (N- ( (2- (2- (2-チエニルメチルアミノ) カルボニル) フ

エニル) フェニル) カルボニル) -N- (2- (4-エトキシフェニル) エ

チル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

10 HPLC保持時間: 3.86 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1121)

3- (N- ( (2- (2- (1-イソブチルアミノ) カルボニル) フェニル)

フェニル) カルボニル) -N- (3-フェニルプロピル) アミノ) プロパン

15 酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.99 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 547 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1122)

20 3- (N- ( (2- (2- (ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニ

ル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (3-フェニルプロピル) ア

ミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

25 HPLC保持時間: 3.25 分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 522 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1123)

- 3- (N- ( (2- (2- (1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (3-フエニルプロピル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.95分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 547 (M+H)<sup>+</sup>.

10 実施例 4 (1124)

- 3- (N- ( (2- (2- (ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (3-フエニルプロピル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.89分;

- 15 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 521 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (1125)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (3-フエニルプロピル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.89分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>.

25 実施例 4 (1126)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)

フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (3-フエニルプロピル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.88分;

- 5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (1127)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (3-フエニルプロピル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 551 (M+H)<sup>+</sup>.

15 実施例 4 (1128)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (3-フエニルプロピル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件: A

- 20 HPLC保持時間: 3.99分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)<sup>+</sup>.

実施例 4 (1129)

- 3- (N- ( (2- (2- ( (N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (3-フエニルプロピル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.93分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 5 実施例 4 (11130)

3- (N- ( (2- (2- ( (2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (3-フェニルプロピル) アミノ)

プロパノ酸

HPLC測定条件：A

10 HPLC保持時間：3.89分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 539 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (11131)

3- (N- ( (2- (2- ( (3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

15 フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (3-フェニルプロピル) アミノ)

プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.93分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 539 (M+H)<sup>+</sup>。

20

#### 実施例 4 (11132)

3- (N- ( (2- (2- ( (4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)

フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (3-フェニルプロピル) アミノ)

プロパノ酸

25 HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.91分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 539 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (11133)

3- (N- ( (2- (2- ( (7-リルアミノ) カルボニル) フェニル) フェ

5 ニル) カルボニル) -N- (3-フェニルプロピル) アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.73分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 963 (2M+Na)<sup>+</sup>, 471 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 10 実施例 4 (11134)

3- (N- ( (2- (2- ( (2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボ

ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (3-フェニルプロピル)

アミノ) プロパノ酸

HPLC測定条件：A

15 HPLC保持時間：3.88分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)<sup>+</sup>。

#### 実施例 4 (11135)

3- (N- ( (2- (2- ( (2-チエニルメチルアミノ) カルボニル) フ

20 エニル) フェニル) カルボニル) -N- (3-フェニルプロピル) アミノ)

プロパノ酸

HPLC測定条件：A

HPLC保持時間：3.86分；

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 527 (M+H)<sup>+</sup>。

25

#### 実施例 4 (11136)

3- (N- ( (2- (2- ( (3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (3-フェニルプロピル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

5 HPLC保持時間: 3.99分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 557 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1137)

10 3- (N- ( (2- (2- ( (2-フェニルエチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (3-フェニルプロピル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.95分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 535 (M+H)<sup>+</sup>。

15

実施例 4 (1138)

3- (N- ( (2- (2- ( (1-イソブチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

20 HPLC保持時間: 3.86分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 519 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1139)

25 3- (N- ( (2- (2- ( (ピリジン-2-イルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A  
HPLC保持時間: 3.18分;  
MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 987 (2M+H)<sup>+</sup>, 494 (M+H)<sup>+</sup>。

5 実施例 4 (1140)

3- (N- ( (2- (2- ( (ピリジン-3-イルメチルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

10 HPLC保持時間: 3.12分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 987 (2M+H)<sup>+</sup>, 494 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1141)

15 3- (N- ( (2- (2- ( (1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン-2-イル) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

HPLC保持時間: 3.82分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 519 (M+H)<sup>+</sup>。

20

実施例 4 (1142)

3- (N- ( (2- (2- ( (ベンジルアミノ) カルボニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロパン酸

HPLC測定条件: A

25 HPLC保持時間: 3.77分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 985 (2M+H)<sup>+</sup>, 493 (M+H)<sup>+</sup>。



実施例 4 (1143)

- 3- (N- ( (2- (2- (2-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロパノ酸  
5 HPLC測定条件: A  
HPLC保持時間: 3.77分;  
MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 523 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1144)

- 10 3- (N- ( (2- (2- (3-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロパノ酸  
HPLC測定条件: A  
HPLC保持時間: 3.73分;  
MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 523 (M+H)<sup>+</sup>。

15

実施例 4 (1145)

- 3- (N- ( (2- (2- (4-メトキシベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロパノ酸  
HPLC測定条件: A  
20 HPLC保持時間: 3.73分;  
MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 523 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1146)

- 3- (N- ( (2- (2- (4-メチルベンジルアミノ) カルボニル) フェ  
ニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロパノ酸  
25 HPLC測定条件: A

415

HPLC保持時間: 3.84分;  
MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 507 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1147)

- 5 3- (N- ( (2- (2- (N-メチル-N-ベンジルアミノ) カルボ  
ニル) フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロパ  
ノ酸  
HPLC測定条件: A  
HPLC保持時間: 3.78分;  
10 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 507 (M+H)<sup>+</sup>, 493。

実施例 4 (1148)

- 3- (N- ( (2- (2- (2-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロパノ酸  
15 HPLC測定条件: A  
HPLC保持時間: 3.77分;  
MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 511 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1149)

- 20 3- (N- ( (2- (2- (3-フルオロベンジルアミノ) カルボニル)  
フェニル) フェニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) プロパノ酸  
HPLC測定条件: A  
HPLC保持時間: 3.78分;  
MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 511 (M+H)<sup>+</sup>。

実施例 4 (1150)

25

416

- 3- (N- ( (2- (2- (4-フルオロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) フロバニン酸
- HPLC測定条件: A
- HPLC保持時間: 3.77分;
- 5 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 511 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例4 (1151)

- 3- (N- ( (2- (2- (7-フルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) フロバニン酸
- 10 HPLC測定条件: A
- HPLC保持時間: 3.58分;
- MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 907 (2M+Na)<sup>+</sup>, 443 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例4 (1152)

- 15 3- (N- ( (2- (2- (2, 6-ジフルオロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) フロバニン酸
- HPLC測定条件: A
- HPLC保持時間: 3.73分;
- 20 MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 529 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例4 (1153)

- 3- (N- ( (2- (2- (2-チエニルメチルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) フロバニン酸
- 25 HPLC測定条件: A
- HPLC保持時間: 3.73分;

MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 997 (2M+H)<sup>+</sup>, 499 (M+H)<sup>+</sup>.

#### 実施例4 (1154)

- 3- (N- ( (2- (2- (3, 5-ジフルオロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (ベンジル) アミノ) フロバニン酸
- 5 HPLC測定条件: A
- HPLC保持時間: 3.86分;
- MASSデータ (ESI, Pos., 20V) : 529 (M+H)<sup>+</sup>.

10

#### [生物化学的実施例]

本発明化合物が、LPA受容体に拮抗作用を有することは、以下の実験によって証明された。例えば、EDG-2に対する拮抗作用は、以下に示す実験等により証明された。

- 15 全体の操作は、基本的な遺伝子工学的手法に基づき、遺伝子高発現細胞を作製し、常法となっている方法を活用した。また、本発明の測定方法は、以下のように、本発明化合物を評価するために、測定精度の向上および/または測定感度の改良を加えたものである。以下に詳細な実験方法を示した。

細胞内カルシウムイオンの濃度変化をモニターすることによるEDG-2拮

#### 20 抗作用の評価

- ヒトEDG-2遺伝子を過剰発現させたチャイニーズハムスターオvaryー (Chinese Hamster Ovary, CHO) 細胞を用いて感受容体アソタキニストの活性評価を行なった。EDG-2発現細胞は、10% FBS (ウシ胎児血清)、ベニシリン/ストレプトマイシン、ブラスチサイジン (5 μg/ml) 含有 Ham's F12 培地 (GIBCO BRL 社製, No.11765-047) を用いて培養した。まず、Fura2-AM (Dojindo 社製, No.348-05831) を細胞内へ取り込ませるため、細胞

- を 5  $\mu$ M Fun2-AM 溶液 (1.0% FBS, 2.0 mM HEPES 緩衝液 (pH 7.4)、2.5 mM プロベネシド (Sigma 社製, No.P-8761) 含有 Ham's F12 培地) で、37°C、60 分間インキュベーションした。次に 2.0 mM HEPES 緩衝液 (pH 7.4)、2.5 mM プロベネシドを含む Hanks 液で 1 回洗浄し、アッセイまで同 Hanks 液に浸した。蛍光ドラッグスクリーニングシステム (浜松ホトニクス社製、FDSS-2000) にプレートセットし、30 秒間無刺激で測定し、式 (1) で示される本発明化合物の溶液を添加した。その 5 分後に LPA (終濃度: 100 nM) を添加して、添加前後の細胞内カルシウムイオン濃度を 3 秒間隔で測定した (励起波長 340 nm および 380 nm、蛍光波長 500 nm)。
- 式 (1) で示される本発明化合物は、ジメチルスルホキシド (DMSO) に溶解し、終濃度が 1 nM ~ 10  $\mu$ M になるように添加した。LPA として、1-リノレノイル (18:3) -LPA を使用した。1-リノレノイル (18:3) -LPA は、18:3-LPC (リノレノイル (18:3) -リノホスファチジルコリン) (Sedary 社製) より PLD (ホスホリパーゼ D) により合成した。EDG-2 拮抗活性は、式 (1) で示される本発明化合物を含まない DMSO を添加したウェルでの LPA (終濃度: 100 nM) によるピーク値をコントロール値 (A) とし、化合物で処理した細胞での LPA 添加前の値から添加後の値の差 (B) とを比較し、以下の数式を用いて抑制率 (%) を算出した。
- $$\text{抑制率 (\%)} = (A - B) / A \times 100$$
- IC<sub>50</sub> 値は、抑制率 50% を示す本発明化合物の濃度として算出した。
- 実施例 3 および実施例 3 (1) で製造した本発明化合物を用いた実験結果を表 1 に示す。

表 1

実施例番号	IC <sub>50</sub> ( $\mu$ mol/L)
実施例 3	0.41
実施例 3 (1)	0.78

## 製剤例 1

以下の各成分を常法により混合した後打錠して、一錠中に 50 mg の活性成分を含有する錠剤 100 錠を得た。

- 5 ・ 3- (N- (2- (2- (4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2, 5-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸 ..... 5.0 g
- ・ カルボキシメチルセルロースカルシウム (助溶剤) ..... 0.2 g
- ・ ステアリン酸マグネシウム (潤滑剤) ..... 0.1 g
- 10 ・ 微結晶セルロース ..... 4.7 g

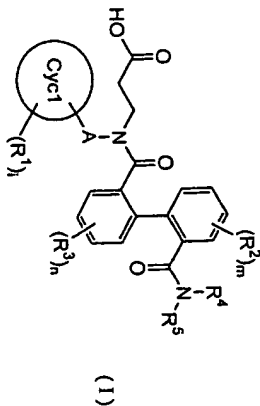
## 製剤例 2

以下の各成分を常法により混合した後、溶液を常法により滅菌し、5 mL すつアンプルに充填し、常法により凍結乾燥し、1 アンプル中 20 mg の活性成分を含有するアンプル 100 本を得た。

- 15 ・ 3- (N- (2- (2- (4-クロロベンジルアミノ) カルボニル) フエニル) フエニル) カルボニル) -N- (2, 5-ジメトキシフエニル) エチル) アミノ) プロパノ酸 ..... 2.0 g
- ・ マンニトール ..... 20 g
- 20 ・ 蒸留水 ..... 1000 mL

## 請求の範囲

## 1. 一般式 (1)



5 [式中、Aは、

(1) C1～6アルキレン基、(2) C2～6アルケニレン基、または(3) C2～6アルキニレン基を被わし (ただし、Aは1～3個のC1～4アルキル基によって置換されてもよい。)

(Cyc1) は、(1) C3～15の炭素原子、または(2) 1～4個の窒素原子、1～2

10 個の酸素原子および/または1～2個の硫黄原子を含む3～15員の複素環を被わし、

R<sup>1</sup>は、

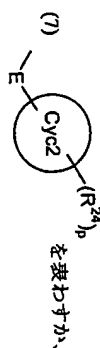
(1) C1～4アルキル基、(2) ハロゲン原子、(3) シアノ基、(4) トリハロメチル基、  
 (5) -OR<sup>6</sup>基、(6) -SR<sup>7</sup>基、(7) -NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>基、(8) ニトロ基、(9) -COOR<sup>10</sup>  
 15 基、(10) -CONR<sup>11</sup>R<sup>12</sup>基、(11) -NR<sup>13</sup>COR<sup>14</sup>基、(12) -SO<sub>2</sub>NR<sup>15</sup>R<sup>16</sup>  
 基、(13) -NR<sup>17</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>18</sup>基、(14) -S(O) R<sup>19</sup>基、または(15) -SO<sub>2</sub>R<sup>20</sup>  
 基を被わし、  
 R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>、R<sup>14</sup>、R<sup>15</sup>、R<sup>16</sup>、R<sup>17</sup>、R<sup>18</sup>、  
 R<sup>19</sup>およびR<sup>20</sup>は、それぞれ独立して、

(1) 水素原子、または(2) C1～4アルキル基を被わし、  
 R<sup>3</sup>およびR<sup>3</sup>は、それぞれ独立して、

(1) C1～4アルキル基、(2) C1～4アルコキシ基、または(3) ハロゲン原子を  
 被わし、

5 R<sup>4</sup>およびR<sup>4</sup>は、それぞれ独立して、

(1) 水素原子、(2) C1～4アルキル基、(3) C2～4アルケニル基、(4) C2～4  
 アルキニル基、(5) -OR<sup>21</sup>基によって置換されたC1～4アルキル基、(6) -  
 NR<sup>22</sup>R<sup>23</sup>基によって置換されたC1～4アルキル基、または



を被わすか、

10 R<sup>4</sup>とR<sup>4</sup>はそれらが結合する窒素原子と一緒になって、3～15員の単環、二  
 環式または三環式複素環 (ただし、複素環は少なくとも一つの窒素原子を  
 含有し、-OR<sup>25</sup>基によって置換されたC1～4アルキル基によって置換され  
 てもよい。) を被わし、

R<sup>21</sup>、R<sup>22</sup>、R<sup>23</sup>およびR<sup>24</sup>は、それぞれ独立して、

15 (1) 水素原子、(2) C1～4アルキル基、(3) C2～6アルキル基、または(4) トリハ  
 ロアセチル基を被わし、

Eは、

(1) 単結合、(2) C1～6アルキレン基、(3) C2～6アルケニレン基、または(4)  
 C2～6アルキニレン基を被わし (ただし、Eは(1) C1～4アルキル基およ  
 20 び(2) -OR<sup>26</sup>から選択される1～3個の基によって置換されたC1～4アル  
 キル基によって置換されてもよい。)、  
 R<sup>26</sup>は、(1) 水素原子、(2) C1～4アルキル基、(3) C2～6アルキル基、または  
 (4) トリハロアセチル基を被わし、

Cyc2 は、(1)C3～15の炭素原子、または(2)1～4個の窒素原子、1～

2個の酸素原子および/または1～2個の硫黄原子を含む3～15員の複素環を表わし、

R<sup>24</sup>は、

- 5 (1)C1～4アルキル基、(2)ハロゲン原子、(3)シアノ基、(4)トリハロメチル基、(5)－OR<sup>27</sup>基、(6)－SR<sup>29</sup>基、(7)－NR<sup>29</sup>R<sup>30</sup>基、(8)ニトロ基、(9)－COOR<sup>31</sup>基、(10)－CONR<sup>32</sup>R<sup>33</sup>基、(11)－NR<sup>34</sup>COR<sup>35</sup>基、(12)－SO<sub>2</sub>NR<sup>36</sup>R<sup>37</sup>基、(13)－NR<sup>38</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>39</sup>基、(14)－S(O)R<sup>40</sup>基、または(15)－SO<sub>2</sub>R<sup>41</sup>基を表わし、

- 10 R<sup>27</sup>、R<sup>28</sup>、R<sup>29</sup>、R<sup>30</sup>、R<sup>31</sup>、R<sup>32</sup>、R<sup>33</sup>、R<sup>34</sup>、R<sup>35</sup>、R<sup>36</sup>、R<sup>37</sup>、R<sup>38</sup>、R<sup>39</sup>、R<sup>40</sup>およびR<sup>41</sup>は、それぞれ独立して、

(1)水素原子、または(2)C1～4アルキル基を表わし、

i は、0または1～5の整数を表わし、

m は、0または1～4の整数を表わし、

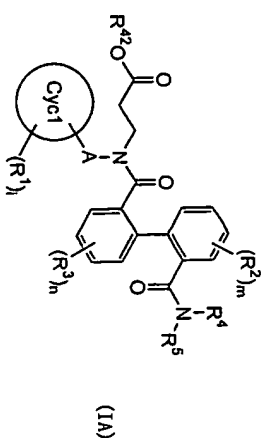
- 15 n は、0または1～4の整数を表わし、

p は、0または1～5の整数を表わす。

- ただし、i が2以上を表わすとき、複数のR<sup>i</sup>は各々同じでも異なってもよく、m が2以上を表わすとき、複数のR<sup>m</sup>は各々同じでも異なってもよく、n が2以上を表わすとき、複数のR<sup>n</sup>は各々同じでも異なってもよく、p が2以上を表わすとき、複数のR<sup>p</sup>は各々同じでも異なってもよい。」

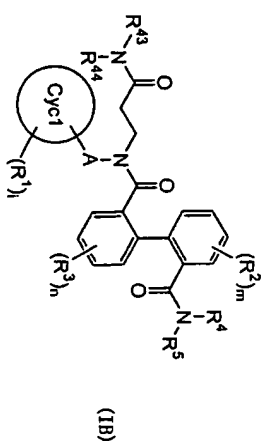
20 で示されるβ-アラニノ誘導体、それらのプロドラッグまたはそれらの塩。

## 2. 一般式 (IA)



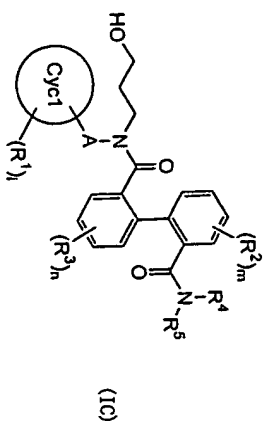
- (式中、R<sup>42</sup>は、(1)C1～8アルキル基、または(2)1～2個の水酸基またはアミノ基によって置換されたC1～8アルキル基を表わし、その他の記号は請求の範囲1の記載と同じ意味を表わす。) で示される請求の範囲1記載のプロドラッグ。

## 3. 一般式 (IB)



- (式中、R<sup>43</sup>およびR<sup>44</sup>は、それぞれ独立して、(1)水素原子、(2)C1～8アルキル基、または(3)1～2個の水酸基またはアミノ基によって置換されたC1～8アルキル基を表わし、その他の記号は請求の範囲1の記載と同じ意味を表わす。) で示される請求の範囲1記載のプロドラッグ。

## 4. 一般式 (IC)



(式中、すべての記号は請求の範囲 1 の記載と同じ意味を表わす。) で示される請求の範囲 1 記載のプロドラッグ。

- 5 5. 請求の範囲 1 記載の化合物、それらのプロドラッグまたはそれらの塩を含有する医薬組成物。
6. LPA 受容体拮抗剤である請求の範囲 5 記載の医薬組成物。
- 10 7. LPA 受容体が EDG-2 受容体である請求の範囲 6 記載の医薬組成物。
8. 泌尿器系疾患の予防および/または治療剤である請求の範囲 7 記載の医薬組成物。
- 15 9. 癌関連疾患、増殖性疾患、炎症・免疫系疾患、分泌障害による疾患、脳関連疾患の予防および/または治療剤である請求の範囲 7 記載の医薬組成物。
10. 請求の範囲 1 記載の化合物、それらのプロドラッグまたはそれらの塩の有効量を哺乳動物に投与することを特徴とする哺乳動物における EDG-2 に起因する疾患の予防および/または治療方法。

11. EDG-2 に起因する疾患が、泌尿器系疾患である請求の範囲 10 記載の予防および/または治療方法。
- 5 12. EDG-2 に起因する疾患が、癌関連疾患、増殖性疾患、炎症・免疫系疾患、分泌障害による疾患、脳関連疾患である請求の範囲 10 記載の予防および/または治療方法。
- 10 13. EDG-2 に起因する疾患の予防または治療剤を製造するための請求の範囲 1 記載の化合物、それらのプロドラッグまたはそれらの塩の使用。
14. EDG-2 に起因する疾患が、泌尿器系疾患である請求の範囲 13 記載の使用。
- 15 15. EDG-2 に起因する疾患が、癌関連疾患、増殖性疾患、炎症・免疫系疾患、分泌障害による疾患、脳関連疾患である請求の範囲 13 記載の使用。
16. 請求の範囲 1 記載の化合物、それらのプロドラッグまたはそれらの塩の有効成分とする LPA 受容体拮抗剤と、他の LPA 受容体拮抗剤、 $\alpha 1$  遮断剤、抗コリン剤、5 $\alpha$ -リダクターゼ阻害剤、および/または抗アンブロゲン剤から選ばれる 1 種または 2 種以上の剤を組み合わせてなる泌尿器系疾患の予防および/または治療剤。

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.  
PCT/JP03/06678

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.  
PCT/JP03/06678

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int. Cl. C07C233/83, 311/46, C07D209/16, 213/40, 217/06, 307/52,  
333/20, 401/12, 405/12, 409/12, 471/04, A61K31/197,  
A61K31/22, 31/222, 31/341, 31/381, 31/4045, 31/437,  
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)  
Int. Cl. C07C231/00-409/44, C07D201/00-521/00, A61K31/00-31/80,  
A61P1/00-43/00

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CA (STN), CAOLD (STN), REGISTRY (STN)

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 01/60819 A1 (Kirin Brewery Co., Ltd.), 23 August, 2001 (23.08.01), & AU 200132340 A	1-9, 13-16
A	WO 01/71022 A2 (THE UNIVERSITY OF TENNESSEE RESEARCH CORP.), 27 September, 2001 (27.09.01), & AU 200149263 A	1-9, 13-16
P, A	JP 2002-212070 A (Ono Pharmaceutical Co., Ltd.), 31 July, 2002 (31.07.02), (Family: none)	1-9, 13-16
P, A	WO 02/092068 A1 (Ono Pharmaceutical Co., Ltd.), 21 November, 2002 (21.11.02), (Family: none)	1-9, 13-16

☐ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☐ See patent family annex.

\* Special categories of cited documents:  
"X" document defining the general state of the art which is not  
considered to be of particular relevance  
"E" earlier document but published on or after the international filing  
date  
"L" document which may throw doubts on priority claimed or which is  
cited to establish the publication date of another citation or other  
special reason (as specified)  
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other  
means  
"P" document published prior to the international filing date but later  
than the priority date claimed  
"F" document published after the international filing date or  
priority date and not in conflict with the invention  
"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be  
considered to be novel or cannot be considered to involve an inventive  
step unless the document is taken alone  
"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be  
considered to involve an inventive step when the document is  
combined with one or more other such documents, such  
combinations being obvious to a person skilled in the art  
"Z" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search  
18 August, 2003 (18.08.03)

Date of mailing of the international search report  
02 September, 2003 (02.09.03)

Name and mailing address of the ISA/  
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (July 1998)

## Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(b) for the following reasons:

1. ☒ Claims Nos.: 10-12

because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:  
claims 10 to 12 pertain to methods for treatment of the human body by therapy  
and thus relate to a subject matter which this international searching  
authority is not required, under the provisions of Article 17(2)(a) (1) of  
the PCT and Rule 39.1(iv) of the Regulations under the PCT, to search.

2. ☐ Claims Nos.:

because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an  
extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:

3. ☐ Claims Nos.:

because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(e).

## Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)

This international Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable  
claims.

2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment  
of any additional fee.

3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers  
only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:

4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is  
restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.

☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

Form PCT/ISA/210 (continuation of first sheet (1)) (July 1998)

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.  
PCT/JPO3/06678

## CONTINUATION OF A CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

(International Patent Classification (IPC))

Int. Cl.<sup>1</sup>

31/4402, 31/4406, 31/4409, 31/443, 31/4436, 31/4439,  
31/444, A61K31/472, 31/4725, A61P1/16, 3/10, 5/14, 9/02  
9/10, 9/14, 11/00, 13/00, 13/02, 13/08, 13/10, 13/12, 17/06,  
19/10, A61P25/00, 25/02, 25/16, 25/28, 27/02, 27/06, 29/00,  
35/00, 35/02, 35/04, 37/00, 43/00

(According to International Patent Classification (IPC) or to both  
national classification and IPC)

## 国際調査報告

国際出願番号 PCT/JPO3/06678

## A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl.<sup>1</sup> C07C33/83, 31/146, C07D209/16, 213/40, 217/06, 307/82, 333/20, 401/12, 405/12, 409/12, 471/04, A61K31/197,  
A61K31/22, 31/222, 31/341, 31/381, 31/4045, 31/437, 31/4402, 31/4406, 31/4409, 31/443, 31/4436, 31/4439, 31/444,  
A61K31/472, 31/4725, A61P1/16, 3/10, 5/14, 9/02, 9/10, 9/14, 11/00, 13/00, 13/02, 13/08, 13/10, 13/12, 17/06, 19/10,

## B. 調査を行った分野 (国際特許分類 (IPC))

調査を行った最小級資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl.<sup>1</sup> C07C231/00-409/44, C07D201/00-521/00, A61K31/00-31/80, A61P1/00-43/00

最小級資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で利用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用組)

CA (STN), C.A.B. (STN), REGISTRY (STN)

## C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー *	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	WO 01/60819 A1 (麒麟麦酒株式会社) 2001.08.23 & AU 200132340 A	1-9, 13-16
A	WO 01/71022 A2 (THE UNIVERSITY OF TENNESSEE RESEARCH CORPORATION) 2001.09.27 & AU 200149263 A	1-9, 13-16
P, A	JP 2002-212070 A (小野薬品工業株式会社) 2002.07.31 (フタミリーなし)	1-9, 13-16
P, A	WO 02/092068 A1 (小野薬品工業株式会社) 2002.11.21 (フタミリーなし)	1-9, 13-16

☐ C欄の並びにも文献が列挙されている。☐ パラグラフミラーに関する別紙を参照。

## \* 引用文献のカテゴリー

(A) 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの  
(E) 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの  
(L) 優先権主張に譲渡する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を明示するために引用する文献 (理由を付す)  
(O) 口頭による開示、使用、展示等に普及する文献  
(P) 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

国際調査を完了した日 18.08.03

国際調査報告の発送日 02.09.03

## 国際調査機関の名称及び住所

日本国特許庁 (JSA/JIP)  
郵便番号 100-8915  
東京都千代田区根が三丁目4番3号

## 特許庁審査官 (関係のある職員)

菊見 武志

4H 9547

電話番号 03-3681-1101 内線 3443



第2ページA. 欄の続き  
A61P25/00, 25/02, 25/16, 25/28, 27/02, 27/06, 29/00, 35/00, 35/02, 35/04, 37/00, 43/00

第1欄 請求の範囲の一部の調査ができないときの意見 (第1ページの2の続き)  
法第8条第3項 (PCT17条(2)(a))の規定により、この国際調査報告は次の理由により請求の範囲の一部について作成しなかった。

1. ☒ 請求の範囲 10-12 は、この国際調査機関が調査することを要しない対象に係るものである。  
つまり、請求の範囲 10-12 は、治療による人体の処置方法に関するものであり、PCT第17条(2)(a)(i)及びPCT規則39.1(iv)の規定により、この国際調査機関が調査をすることを要しない対象に係るものである。

2. ☐ 請求の範囲 は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない国際出願の部分に係るものである。つまり、

3. ☐ 請求の範囲 は、従属請求の範囲であってPCT規則6.4(a)の第2文及び第3文の規定に従って記載されていない。

第II欄 発明の単一性が欠如しているときの意見 (第1ページの3の続き)

次に述べるようにこの国際出願に二以上の発明があるとこの国際調査機関は認めた。

1. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料をすべて期間内に納付したので、この国際調査報告は、すべての調査可能な請求の範囲について作成した。

2. ☐ 追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求の範囲について調査することができたので、追加調査手数料の納付を求めなかった。

3. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料の一部のみが期間内に納付しなかったため、この国際調査報告は、手数料の納付のあった次の請求の範囲のみについて作成した。

4. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を期間内に納付しなかったため、この国際調査報告は、請求の範囲の条項に記載されている発明に係る次の請求の範囲について作成した。

追加調査手数料の異議の申立てに関する注意

- ☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがあった。  
☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがなかった。